

明 細 書

発明の名称： 含窒素ヘテロ環化合物ならびに農園芸用殺菌剤

技術分野

[0001] 本発明は、新規な含窒素ヘテロ環化合物、ならびに該含窒素ヘテロ環化合物から選ばれる少なくとも１種を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。

本願は、２０１０年１月４日に日本に出願された特願２０１０－０００１９４号に基づき優先権を主張し、その内容をここに援用する。

背景技術

[0002] 農園芸作物の栽培に当り、作物の病害に対して多数の防除薬剤が使用されているが、その防除効力が不十分であったり、薬剤耐性の病原菌の出現によりその使用が制限されたり、植物体に薬害や汚染を生じさせたり、若しくは人畜魚類に対する毒性や環境への影響が大きかったりなどで、防除薬剤として十分に満足できるものは多くない。そのため、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の出現が強く要望されている。

[0003] 本発明に関連して、下記特許文献１または２には、本発明化合物と類似の化学構造を有するキノリン誘導体、およびそれを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤が開示されている。

先行技術文献

特許文献

[0004] 特許文献１：WO 2005/070917号パンフレット

特許文献２：WO 2007/011022号パンフレット

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0005] 本発明は、新規な含窒素ヘテロ環化合物、およびその塩若しくはN-オキサイド化合物、ならびに該含窒素ヘテロ環化合物、およびその塩若しくはN-オキサイド化合物から選ばれる少なくとも１種を有効成分として含有する

効果が確実で安全に使用できる農園芸用殺菌剤を提供することを課題とする。

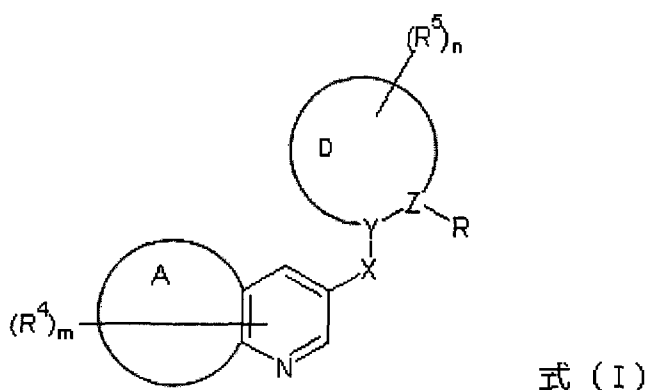
課題を解決するための手段

[0006] 本発明者らは、上記課題を解決すべく鋭意検討した。その結果、式（I）で表される含窒素ヘテロ環化合物、およびその塩若しくはN-オキサイド化合物を得るに至った。そして、この含窒素ヘテロ環化合物、およびその塩若しくはN-オキサイド化合物は、効果が確実で安全に使用できる農園芸用殺菌剤の有効成分として有用であることを見出した。本発明は、これらの知見に基づきさらに検討し完成するに至ったものである。

[0007] すなわち、本発明は以下の態様を包含するものである。

〈1〉 式（I）で表される含窒素ヘテロ環化合物、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物。

[0008] [化1]



[0009] 式（I）中、Rは、 $CR^1R^2R^3$ で表される基、無置換の若しくは置換基を有するC6～10アリール基、またはシアノ基を表す。

$R^1 \sim R^3$ は、夫々独立して、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するC1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC2～8アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC2～8アルキニル基、無置換の若しくは置換基を有するC3～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC4～8シクロアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若

しくは置換基を有するC 1～8アシル基、無置換の若しくは置換基を有する（1-イミノ）C 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するカルボキシル基、無置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するメルカプト基、置換基を有するスルホニル基、ハロゲノ基、シアノ基、またはニトロ基を示す。

但し、 $R^1 \sim R^3$ は、全てが水素原子であることはない。また、 $R^1 \sim R^3$ は、全てが無置換のC 1～8アルキル基であることはない。また、 $R^1 \sim R^3$ は、いずれかひとつが水素原子である場合、残る二つ全てが、無置換のC 1～8アルキル基であることはない。また、 $R^1 \sim R^3$ は、いずれかひとつが無置換のC 1～8アルキル基である場合、残る二つ全てが、水素原子であることはない。

R^1 と R^2 は一緒になって、無置換の若しくは置換基を有する5～8員環を形成してもよいし、または $O=$ 、 $R^a R^b C=$ 若しくは $R' - N=$ を形成してもよい。

R^a は、水素原子または無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基を示す。

R^b は、水素原子または無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基を示す。

R' は、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、または無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基を示す。

R^4 は、夫々独立して、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～8アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～8アルキニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 4～8シクロアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アシル基、無置換の若しくは置換基を有する（1-イミノ）

C 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するカルボキシ基、無置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するメルカプト基、置換基を有するスルホニル基、ハロゲノ基、シアノ基、またはニトロ基を示す。

mは、R⁴の個数を示し、0～6のいずれかの整数である。

R⁵は、夫々独立して、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～8アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～8アルキニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 4～8シクロアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アシル基、無置換の若しくは置換基を有する(1-イミノ) C 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するカルボキシ基、無置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するメルカプト基、置換基を有するスルホニル基、ハロゲノ基、シアノ基、またはニトロ基を示す。

nは、R⁵の個数を示し、0～5のいずれかの整数である。

R¹～R³のいずれかひとつと、R⁵のいずれかひとつとは、一緒になって、無置換の若しくは置換基を有する5～8員環を形成してもよい。

Aは、RがC R¹R²R³で表される基のとき、5～7員炭化水素環または5～7員ヘテロ環を示し、Rが無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基またはシアノ基のとき、ベンゼン環を表す。

Dは、5～7員炭化水素環または5～7員ヘテロ環を示す。

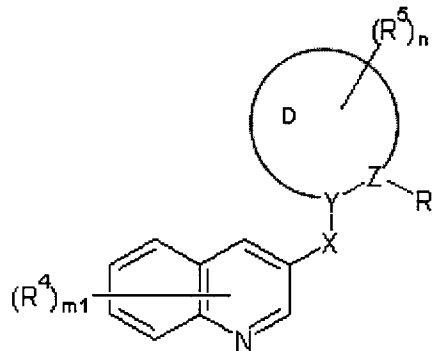
Xは、酸素原子、硫黄原子、スルフェニル基、スルホニル基、無置換の若しくは置換基を有する炭素原子、または無置換の若しくは置換基を有する窒素原子を示す。

Yは、炭素原子または窒素原子を示す。

Zは、炭素原子または窒素原子を示す。

[0010] 〈2〉 式 (II) で表される含窒素ヘテロ環化合物、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物。

[0011] [化2]



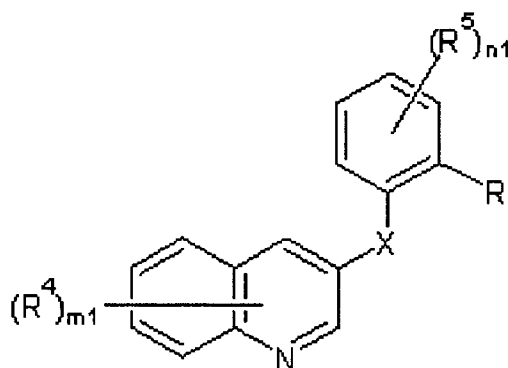
式 (II)

式 (II) 中、R、R⁴、R⁵、n、D、X、YおよびZは、前記〈1〉に記載の式 (I) 中のそれぞれと同じ意味を示す。

m₁は、R⁴の個数を示し、0～6のいずれかの整数である。

[0012] 〈3〉 式 (III) で表される含窒素ヘテロ環化合物、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物。

[0013] [化3]



式(III)

式 (III) 中、R、R⁴、R⁵、m₁およびXは、前記〈2〉に記載の式 (II) 中のそれぞれと同じ意味を示す。

n₁は、R⁵の個数を示し、0～4のいずれかの整数である。

[0014] 〈4〉 前記〈1〉～〈3〉のいずれか1項に記載の含窒素ヘテロ環化合物

、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物から選ばれる少なくとも1種を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

- [0015] 〈5〉 8-フルオロ-3-ヒドロキシキノリン、7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシキノリン、7, 8-ジフルオロ-3-ヨードキノリン、8-フルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリン、または7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリンから選ばれる請求項1に記載の式(I)で表される含窒素ヘテロ環化合物、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物の製造中間体。

発明の効果

- [0016] 本発明の含窒素ヘテロ環化合物、およびその塩若しくはN-オキサイド化合物は、効果が確実で安全に使用できる農園芸用殺菌剤の有効成分として有用な新規化合物である。

本発明の農園芸用殺菌剤は優れた防除効果を有し、植物体に薬害を生じることがなく、人畜魚類に対する毒性や環境への影響が少ない薬剤である。

発明を実施するための形態

- [0017] 以下、本発明を、1) 式(I)で表される含窒素ヘテロ環化合物、およびその塩若しくはN-オキサイド化合物、ならびに2) 農園芸用殺菌剤に項分けて詳細に説明する。

- [0018] 1) 式(I)で表される含窒素ヘテロ環化合物、およびその塩若しくはN-オキサイド化合物

本発明に係る含窒素ヘテロ環化合物は、式(I)で表される化合物(以下、「化合物(I)」と表記することがある。)、好ましくは式(II)で表される化合物(以下、「化合物(II)」と表記することがある。)、より好ましくは式(III)で表される化合物(以下、「化合物(III)」と表記することがある。)である。

- [0019] 本発明に係る含窒素ヘテロ環化合物、およびその塩若しくはN-オキサイド化合物には、水和物、各種溶媒和物や結晶多形などが含まれる。さらに、本発明に係る含窒素ヘテロ環化合物、およびその塩若しくはN-オキサイド

化合物は、不斉炭素原子、二重結合などに基づく立体異性体およびそれらの混合物を包含する。

[0020] まず、式 (I)、(II) および (III) における、「無置換の」および「置換基を有する」の意味を説明する。本明細書における、「無置換の」の用語は、母核となる基のみであることを意味する。「置換基を有する」との記載がなく母核となる基の名称のみで記載しているときは、別段の断りがない限り「無置換の」意味である。

一方、「置換基を有する」の用語は、母核となる基のいずれかの水素原子が、母核と同一または異なる構造の基で置換されていることを意味する。従って、「置換基」は、母核となる基に結合した他の基である。置換基は1つであってもよいし、2つ以上であってもよい。2つ以上の置換基は同一であってもよいし、異なるものであってもよい。

「C 1～6」などの用語は、母核となる基の炭素原子数が1～6個などであることを表している。この炭素原子数には、置換基の中に在る炭素原子の数を含まない。例えば、置換基としてエトキシ基を有するブチル基は、C 2 アルコキシ C 4 アルキル基に分類する。

[0021] 「置換基」は化学的に許容され、本発明の効果を有する限りにおいて特に制限されない。

「置換基」となり得る基としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などのハロゲン原子；メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基などのC 1～6 アルキル基；シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC 3～6 シクロアルキル基；ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基。

ル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基などのC2～6アルケニル基； 2-シクロプロペニル基、2-シクロペンテニル基、3-シクロヘキセニル基などのC3～6シクロアルケニル基； エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、2-メチル-3-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などのC2～6アルキニル基；

[0022] メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、s-ブトキシ基、i-ブトキシ基、t-ブトキシ基などのC1～6アルコキシ基； ビニルオキシ基、アリルオキシ基、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基などのC2～6アルケニルオキシ基； エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などのC2～6アルキニルオキシ基； フェニル基、ナフチル基などのC6～10アリール基； フェノキシ基、1-ナフトキシ基などのC6～10アリールオキシ基； ベンジル基、フェネチル基などのC7～11アラルキル基； ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのC7～11アラルキルオキシ基； ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基、シクロヘキシルカルボニル基などのC1～7アシル基； ホルミルオキシ基、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、シクロヘキシルカルボニルオキシ基などのC1～7アシルオキシ基； メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基などのC1～6アルコキシカルボニル基； カルボキシル基；

[0023] 水酸基； オキソ基； クロロメチル基、クロロエチル基、トリフルオロメチル基、1, 2-ジクロロ-n-プロピル基、1-フルオロ-n-ブチル基、パーフルオロ-n-ペンチル基などのC1～6ハロアルキル基； 2-

クロロ-1-プロペニル基、2-フルオロ-1-ブテニル基などのC2~6ハロアルケニル基； 4, 4-ジクロロ-1-ブチニル基、4-フルオロ-1-ペンチニル基、5-ブロモ-2-ペンチニル基などのC2~6ハロアルキニル基； 2-クロロ-n-プロポキシ基、2, 3-ジクロロブトキシ基などのC1~6ハロアルコキシ基； 2-クロロプロペニルオキシ基、3-ブロモブテニルオキシ基などのC2~6ハロアルケニルオキシ基； 4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基などのC6~10ハロアリール基； 4-フルオロフェニルオキシ基、4-クロロ-1-ナフトキシ基などのC6~10ハロアリールオキシ基； クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4-クロロベンゾイル基などのC1~7ハロアシル基；

[0024] シアノ基； イソシアノ基； ニトロ基； イソシアナト基； シアナト基； アジド基； アミノ基； メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基などのC1~6アルキルアミノ基； アニリノ基、ナフチルアミノ基などのC6~10アリールアミノ基； ベンジルアミノ基、フェニルエチルアミノ基などのC7~11アラルキルアミノ基； ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、ブチリルアミノ基、i-プロピルカルボニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基などのC1~7アシルアミノ基； メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、n-プロポキシカルボニルアミノ基、i-プロポキシカルボニルアミノ基などのC1~6アルコキシカルボニルアミノ基； カルバモイル基； ジメチルカルバモイル基、フェニルカルバモイル基、N-フェニル-N-メチルカルバモイル基などの置換カルバモイル基； イミノメチル基、(1-イミノ)エチル基、(1-イミノ)-n-プロピル基などのイミノC1~6アルキル基； ヒドロキシイミノメチル基、(1-ヒドロキシイミノ)エチル基、(1-ヒドロキシイミノ)プロピル基などのヒドロキシイミノC1~6アルキル基； メトキシイミノメチル基、(1-メトキシイミノ)エチル基などのC1~6アルコキシイミノC1~6アルキル基；

- [0025] メルカプト基； イソチオシアナト基； チオシアナト基； メチルチオ基、エチルチオ基、*n*-プロピルチオ基、*i*-プロピルチオ基、*n*-ブチルチオ基、*i*-ブチルチオ基、*s*-ブチルチオ基、*t*-ブチルチオ基などのC 1～6アルキルチオ基； ビニルチオ基、アリルチオ基などのC 2～6アルケニルチオ基； エチニルチオ基、プロパルギルチオ基などのC 2～6アルキニルチオ基； フェニルチオ基、ナフチルチオ基などのC 6～10アリールチオ基； チアゾリルチオ基、ピリジルチオ基などのヘテロアリールチオ基； ベンジルチオ基、フェネチルチオ基などのC 7～11アラルキルチオ基； （メチルチオ）カルボニル基、（エチルチオ）カルボニル基、（*n*-プロピルチオ）カルボニル基、（*i*-プロピルチオ）カルボニル基、（*n*-ブチルチオ）カルボニル基、（*i*-ブチルチオ）カルボニル基、（*s*-ブチルチオ）カルボニル基、（*t*-ブチルチオ）カルボニル基などの（C 1～6アルキルチオ）カルボニル基；
- [0026] メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、*t*-ブチルスルフィニル基などのC 1～6アルキルスルフィニル基； アリルスルフィニル基などのC 2～6アルケニルスルフィニル基； プロパルギルスルフィニル基などのC 2～6アルキニルスルフィニル基； フェニルスルフィニル基などのC 6～10アリールスルフィニル基； チアゾリルスルフィニル基、ピリジルスルフィニル基などのヘテロアリールスルフィニル基； ベンジルスルフィニル基、フェネチルスルフィニル基などのC 7～11アラルキルスルフィニル基； メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、*t*-ブチルスルホニル基などのC 1～6アルキルスルホニル基； アリルスルホニル基などのC 2～6アルケニルスルホニル基； プロパルギルスルホニル基などのC 2～6アルキニルスルホニル基； フェニルスルホニル基などのC 6～10アリールスルホニル基； チアゾリルスルホニル基、ピリジルスルホニル基などのヘテロアリールスルホニル基； ベンジルスルホニル基、フェネチルスルホニル基などのC 7～11アラルキルスルホニル基；
- [0027] ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オ

キサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などの5員ヘテロアリール基；ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダニル基、トリアジニル基などの6員ヘテロアリール基；アジリジニル基、エポキシ基、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基などの飽和ヘテロ環基；トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、*t*-ブチルジメチルシリル基などのトリC1～6アルキルシリル基；トリフェニルシリル基；などを挙げることができる。

[0028] また、これらの「置換基」はさらに別の「置換基」を有するものであってもよい。

[0029] [R]

Rは、 $CR^1R^2R^3$ で表される基、無置換の若しくは置換基を有するC6～10アリール基、またはシアノ基を表す。

$R^1 \sim R^3$ は、夫々独立して、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するC1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC2～8アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC2～8アルキニル基、無置換の若しくは置換基を有するC3～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC4～8シクロアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有するC1～8アシル基、無置換の若しくは置換基を有する(1-イミノ)C1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するカルボキシ基、無置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するメルカプト基、置換基を有するスルホニル基、ハロゲノ基、シアノ基、またはニトロ基を示す。

但し、 $R^1 \sim R^3$ は、全てが水素原子であることはない。また、 $R^1 \sim R^3$ は、全てが無置換のC1～8アルキル基であることはない。また、 $R^1 \sim R^3$ は、い

いずれかひとつが水素原子である場合、残る二つ全てが、無置換のC 1～8アルキル基であることはない。また、R¹～R³は、いずれかひとつが無置換のC 1～8アルキル基である場合、残る二つ全てが、水素原子であることはない。

[0030] 「C 1～8アルキル基」は、炭素原子 1～8 個で構成される飽和炭化水素基である。C 1～8アルキル基は直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。C 1～8アルキル基としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、n-ヘプチル基、n-オクチル基、i-プロピル基、i-ブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基、i-ペンチル基、ネオペンチル基、2-メチルブチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、i-ヘキシル基などが挙げられる。これらのうち、C 1～6アルキル基が好ましい。

[0031] 「置換基を有するC 1～8アルキル基」としては、

シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基などのシクロアルキルアルキル基、好ましくはC 3～6シクロアルキルC 1～6アルキル基；

シクロペンテニルメチル基、3-シクロペンテニルメチル基、3-シクロヘキセニルメチル基、2-（3-シクロヘキセニル）エチル基などのシクロアルケニルアルキル基、好ましくはC 4～6シクロアルケニルC 1～6アルキル基；

フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、4-フルオロブチル基、4-クロロブチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル基、パーフルオロヘキシル基、パークロロヘキシル基、パーフルオロオクチル基、パークロロオクチル基、2, 4, 6-トリクロロヘキシル基、パーフルオロデシル基、

2, 2, 4, 4, 6, 6-ヘキサクロロオクチル基などのハロアルキル基、好ましくはC 1~6ハロアルキル基；

ベンジル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基などのアリールアルキル基（アラルキル基）、好ましくはC 6~10アリールC 1~6アルキル基；

[0032] 2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、2-（2-ピリジル）エチル基、2-（3-ピリジル）エチル基、2-（4-ピリジル）エチル基、3-（2-ピリジル）プロピル基、3-（3-ピリジル）プロピル基、3-（4-ピリジル）プロピル基、2-ピラジニルメチル基、3-ピラジニルメチル基、2-（2-ピラジニル）エチル基、2-（3-ピラジニル）エチル基、3-（2-ピラジニル）プロピル基、3-（3-ピラジニル）プロピル基、2-ピリミジルメチル基、4-ピリミジルメチル基、2-（2-ピリミジル）エチル基、2-（4-ピリミジル）エチル基、3-（2-ピリミジル）プロピル基、3-（4-ピリミジル）プロピル基、2-フリルメチル基、3-フリルメチル基、2-（2-フリル）エチル基、2-（3-フリル）エチル基、3-（2-フリル）プロピル基、3-（3-フリル）プロピル基などのヘテロアリールアルキル基、好ましくは5~6員ヘテロアリールC 1~6アルキル基；

ヒドロキシメチル基、1-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシプロピル基、3-ヒドロキシプロピル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル基、2-ヒドロキシ-1, 1-ジメチルエチル基、2-ヒドロキシ-1, 1-ジメチルプロピル基、2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル基などのヒドロキシアルキル基、好ましくはヒドロキシC 1~6アルキル基；

メトキシメチル基、エトキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、メトキシn-プロピル基、n-プロポキシメチル基、i-プロポキシエチル基、s-ブトキシメチル基、t-ブトキシエチル基、2, 2-ジメトキシエチル基、2, 2-ジメトキシ-1, 1-ジメチルエチル基な

どのアルコキシアルキル基、好ましくはC 1～6アルコキシC 1～6アルキル基；

ホルミルオキシメチル基、アセトキシメチル基、2-アセトキシエチル基、プロピオニルオキシメチル基、プロピオニルオキシエチル基などのアシルオキシアルキル基、好ましくはC 1～7アシルオキシC 1～6アルキル基；

トリメチルシリルオキシメチル基、t-ブチルジメチルシリルオキシメチル基などのトリアルキルシリルオキシアルキル基、好ましくはトリC 1～6アルキルシリルオキシC 1～6アルキル基；

トシルオキシメチル基、2-トシルオキシ-1, 1-ジメチルエチル基などのアリールスルホニルオキシアルキル基、好ましくはC 1～6アルキル置換C 6～10アリールスルホニルオキシC 1～6アルキル基；

シアノメチル基、2-シアノエチル基、1-シアノ-1-メチルエチル基などのシアノアルキル基、好ましくはシアノC 1～6アルキル基；

ホルミルメチル基、2-ホルミルエチル基、3-ホルミルプロピル基、1-ホルミル-1-メチルエチル基、2-ホルミル-1, 1-ジメチルエチル基、アセチルメチル基、2-アセチルエチル基、3-アセチルプロピル基、1-アセチル-1-メチルエチル基、2-アセチル-1, 1-ジメチルエチル基などのアシルアルキル基、好ましくはC 1～6アシルC 1～6アルキル基；

2-ヒドロキシイミノエチル基、2-ヒドロキシイミノ-1-メチルエチル基、2-ヒドロキシ-1, 1-ジメチルエチル基、2-ヒドロキシイミノプロピル基などの2-ヒドロキシイミノアルキル基、好ましくは2-ヒドロキシイミノC 2～6アルキル基；

アセチルメチル基、2-アセチルエチル基、3-アセチルプロピル基、1-アセチル-1-メチルエチル基、2-アセチル-1, 1-ジメチルエチル基などのアシルアルキル基、好ましくはホルミルC 1～6アルキル基；

カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、3-カルボキシプロピル基、1-カルボキシ-1-メチルエチル基、2-カルボキシ-1, 1-ジメ

チルエチル基などのカルボキシアルキル基、好ましくはカルボキシC 1～6アルキル基；

メトキシカルボニルメチル基、2-メトキシカルボニルエチル基、3-メトキシカルボニルプロピル基、1-メトキシカルボニル-1-メチルエチル基、2-メトキシカルボニル-1, 1-ジメチルエチル基などのアルコキシカルボニルアルキル基、好ましくはC 1～6アルコキシカルボニルC 1～6アルキル基；

アジドメチル基、2-アジドエチル基、1-アジド-1-メチルエチル基などのアジドアルキル基、好ましくはアジドC 1～6アルキル基；などが挙げられる。

[0033] 「C 2～8アルケニル基」は、少なくとも1つ炭素-炭素二重結合を有する炭素原子2～8個で構成される不飽和炭化水素基である。C 2～8アルケニル基は直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。C 2～8アルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、イソプロペニル基、アリル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基、1-ヘプテニル基、6-ヘプテニル基、1-オクテニル基、7-オクテニル基、1-メチル-アリル基、2-メチル-アリル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基などが挙げられる。これらのうち、C 2～6アルケニル基が好ましい。

[0034] 「置換基を有するC 2～8アルケニル基」としては、3-クロロ-2-プロペニル基、4-クロロ-2-ブテニル基、4, 4-ジクロロ-3-ブテニル基、4, 4-ジフルオロ-3-ブテニル基、3, 3-ジクロロ-2-プロペニル基、2, 3-ジクロロ-2-プロペニル基、3, 3-ジフルオロ-2-プロペニル基、2, 4, 6-トリクロロ-2-ヘキセニル基などのハロアルケニル基、好ましくはC 2～6ハロアルケニル基；

3-ヒドロキシ-1-プロペニル基、4-ヒドロキシ-1-ブテニル基、

1-ヒドロキシアリル基、1-ヒドロキシ-2-メチルアリル基などのヒドロキシアルケニル基、好ましくはヒドロキシC2~6アルケニル基；などが挙げられる。

[0035] 「C2~8アルキニル基」は、少なくとも1つ炭素-炭素三重結合を有する炭素原子2~8個で構成される不飽和炭化水素基である。C2~8アルキニル基は直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。C2~8アルキニル基としては、エチニル基、1-プロピニル基、プロパルギル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、2-メチル-3-ペンチニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などが挙げられる。これらのうち、C2~6アルキニル基が好ましい。

[0036] 「置換基を有するC2~8アルキニル基」としては、3-クロロ-1-プロピニル基、3-クロロ-1-ブチニル基、3-ブロモ-1-ブチニル基、3-ブロモ-2-プロピニル基、3-ヨード-2-プロピニル基、3-ブロモ-1-ヘキシニル基、4, 4, 6, 6-テトラフルオロ-1-ドデシニル基、5, 5-ジクロロ-2-メチル-3-ペンチニル基、4-クロロ-1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などのハロアルキニル基、好ましくはC2~6ハロアルキニル基などが挙げられる。

[0037] 「C3~8シクロアルキル基」は、環状部分を有する炭素原子3~8個で構成されるアルキル基である。C3~8シクロアルキル基としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基などが挙げられる。これらのうち、C3~6シクロアルキル基が好ましい。

[0038] 「置換基を有するC3~8シクロアルキル基」としては、2, 3, 3-トリメチルシクロブチル基、4, 4, 6, 6-テトラメチルシクロヘキシル基、1, 3-ジブチルシクロヘキシル基などのアルキル置換シクロアルキル基

、好ましくはC 1～6アルキル基が1～3個置換したC 3～6シクロアルキル基などが挙げられる。

[0039] 「C 4～8シクロアルケニル基」は、環状部分を有する炭素原子4～8個で構成されるアルケニル基である。C 4～8シクロアルケニル基としては、1-シクロブテニル基、1-シクロペンテニル基、3-シクロペンテニル基、1-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基、3-シクロヘプテニル基、4-シクロオクテニル基などが挙げられる。

[0040] 「置換基を有するC 4～8シクロアルケニル基」としては、2-メチルー3-シクロヘキセニル基、3, 4-ジメチルー3-シクロヘキセニル基などのアルキル置換シクロアルケニル基、好ましくはC 1～6アルキル基が1～3個置換したC 4～6シクロアルケニル基などが挙げられる。

[0041] 「C 6～10アリール基」は、単環または多環の炭素数6～10のアリール基である。なお、多環アリール基は、少なくとも一つの環が芳香環であれば、残りの環が飽和脂環、不飽和脂環または芳香環のいずれであってもよい。C 6～10アリール基としては、フェニル基、ナフチル基、アズレニル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などが挙げられる。これらのうち、フェニル基が好ましい。

「置換基を有するC 6～10アリール基」としては、2-クロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-メトキシ-1-ナフチル基などの、アルキル置換アリール基、ハロゲノ置換アリール基、アルコキシ置換アリール基、好ましくはC 1～6アルキル置換C 6～10アリール基、ハロゲノ置換C 6～10アリール基、C 1～6アルコキシ置換アリール基が挙げられる。

[0042] 「ヘテロ環基」は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1～4個のヘテロ原子を環の構成原子として含むものである。ヘテロ環基は、単環であってもよいし、多環であってもよい。

ヘテロ環基としては、5員ヘテロアリール基、6員ヘテロアリール基、縮

合ヘテロアリール基、飽和ヘテロ環基、部分不飽和ヘテロ環基などが挙げられる。

[0043] 5員ヘテロアリール基としては、ピロール-1-イル基、ピロール-2-イル基、ピロール-3-イル基などのピロリル基；フラン-2-イル基、フラン-3-イル基などのフリル基；チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基などのチエニル基；イミダゾール-1-イル基、イミダゾール-2-イル基、イミダゾール-4-イル基、イミダゾール-5-イル基などのイミダゾリル基；ピラゾール-1-イル基、ピラゾール-3-イル基、ピラゾール-4-イル基、ピラゾール-5-イル基などのピラゾリル基；オキサゾール-2-イル基、オキサゾール-4-イル基、オキサゾール-5-イル基などのオキサゾリル基；イソオキサゾール-3-イル基、イソオキサゾール-4-イル基、イソオキサゾール-5-イル基などのイソオキサゾリル基；チアゾール-2-イル基、チアゾール-4-イル基、チアゾール-5-イル基などのチアゾリル基；イソチアゾール-3-イル基、イソチアゾール-4-イル基、イソチアゾール-5-イル基などのイソチアゾリル基；1, 2, 3-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-4-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-5-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-5-イル基などのトリアゾリル基；1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル基、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル基、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル基などのオキサジアゾリル基；1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル基、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル基、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基などのチアジアゾリル基；テトラゾール-1-イル基、テトラゾール-2-イル基などのテトラゾリル基；などが挙げられる。

[0044] 6員ヘテロアリール基としては、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基などのピリジリル基；ピラジン-2-イル基、ピラジン-3-イル基などのピラジニル基；ピリミジン-2-イル基

、ピリミジン-4-イル基、ピリミジン-5-イル基などのピリミジニル基；
ピリダジン-3-イル基、ピリダジン-4-イル基などのピリダジニル基；
トリアジニル基；などが挙げられる。

[0045] 縮合ヘテロアリール基としては、インドール-1-イル基、インドール-2-イル基、インドール-3-イル基、インドール-4-イル基、インドール-5-イル基、インドール-6-イル基、インドール-7-イル基；
ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾフラン-3-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-6-イル基、ベンゾフラン-7-イル基；
ベンゾチオフェン-2-イル基、ベンゾチオフェン-3-イル基、ベンゾチオフェン-4-イル基、ベンゾチオフェン-5-イル基、ベンゾチオフェン-6-イル基、ベンゾチオフェン-7-イル基；
ベンゾイミダゾール-1-イル基、ベンゾイミダゾール-2-イル基、ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾイミダゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-2-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-2-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基；
キノリン-2-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-4-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-7-イル基、キノリン-8-イル基；などが挙げられる。

[0046] その他のヘテロ環基としては、アジリジン-1-イル基、アジリジン-2-イル基、オキシラニル基などの3員飽和ヘテロ環；
ピロリジン-1-イル基、ピロリジン-2-イル基、ピロリジン-3-イル基、テトラヒドロフラン-2-イル基、テトラヒドロフラン-3-イル基、[1, 3] ジオキシラン-2-イル基などの5員飽和ヘテロ環；
ピペリジン-1-イル基、ピペリジン-2-イル基、ピペリジン-3-イル基、ピペリジン-4-イル基、ピペラジン-1-イル基、ピペラジン-2-イル基、モルホリン-2-イル基、モルホリン-3-イル基、モルホリン-4-イル基などの6員飽和ヘテロ環；
1, 3-ベンゾジオキサール-4-イル基、1, 3-ベンゾジ

オキソールー5-イル基、1, 4-ベンゾジオキサンー5-イル基、1, 4-ベンゾジオキサンー6-イル基、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾジオキセピンー6-イル基、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾジオキセピンー7-イル基、2, 3-ジヒドロベンゾフランー4-イル基、2, 3-ジヒドロベンゾフランー5-イル基、2, 3-ジヒドロベンゾフランー6-イル基、2, 3-ジヒドロベンゾフランー7-イル基；などが挙げられる。

[0047] 「置換基を有するヘテロ環基」としては、4-クロロ-2-ピリジニル基、3-クロロ-2-ピラジニル基、4-メチル-2-ピリジニル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリミジニル基、3-メチル-2-キノリル基などが挙げられる。

[0048] 「C 1～8アシル基」は、水素原子、C 1～7アルキル基、C 2～7アルケニル基、C 2～7アルキニル基、C 6～7アリール基、または5～7員ヘテロ環基が、カルボニル基と結合した基である。

C 1～8アシル基としては、ホルミル基； アセチル基、プロピオニル基、n-プロピルカルボニル基、n-ブチルカルボニル基、ペンタノイル基、バレリル基、オクタノイル基、i-プロピルカルボニル基、i-ブチルカルボニル基、ピバロイル基、イソバレリル基などのアルキルカルボニル基、好ましくはC 1～6アルキルカルボニル基； アクリロイル基、メタクリロイル基などのアルケニルカルボニル基、好ましくはC 2～6アルケニルカルボニル基； プロピオロイル基などのアルキニルカルボニル基、好ましくはC 2～6アルキニルカルボニル基； ベンゾイル基などのアリールカルボニル基； 2-ピリジルカルボニル基、チエニルカルボニル基などのヘテロ環カルボニル基などが挙げられる。

[0049] 「置換基を有するC 1～8アシル基」としては、モノフルオロアセチル基、モノクロロアセチル基、モノブromoアセチル基、ジフルオロアセチル基、ジクロロアセチル基、ジブromoアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、トリブromoアセチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロ

ピオニル基、3, 3, 3-トリクロロプロピオニル基、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピオニル基などのハロアシル基、好ましくはC 1~7ハロアシル基などが挙げられる。

[0050] 「(1-イミノ) C 1~8アルキル基」は、イミノメチル基、若しくはC 1~7のアルキル基がイミノメチル基と結合した基である。(1-イミノ) C 1~8アルキル基としては、イミノメチル基、(1-イミノ) エチル基、(1-イミノ) プロピル基、(1-イミノ) ブチル基、(1-イミノ) ペンチル基、(1-イミノ) ヘキシル基、(1-イミノ) ヘプチル基などが挙げられる。これらのうち、(1-イミノ) C 1~6アルキル基が好ましい。

「置換基を有する(1-イミノ) C 1~8アルキル基」としては、ヒドロキシイミノメチル基、(1-ヒドロキシイミノ) エチル基、(1-ヒドロキシイミノ) プロピル基、(1-ヒドロキシイミノ) ブチル基などの(1-ヒドロキシイミノ) アルキル基、好ましくは(1-ヒドロキシイミノ) C 1~6アルキル基；メトキシイミノメチル基、(1-エトキシイミノ) メチル基、(1-メトキシイミノ) エチル基、(1-tert-ブトキシイミノ) エチル基、(1-エトキシイミノ) エチル基などの(1-アルコキシイミノ) アルキル基、好ましくは(1-(C 1~6アルコキシ) イミノ) C 1~6アルキル基；などが挙げられる。

[0051] 「置換基を有するカルボキシル基」は、C 1~6アルキル基、C 2~6アルケニル基、C 2~6アルキニル基、C 6~10アリール基、C 6~10アリールC 1~6アルキル基、または5~6員ヘテロ環基が、カルボニル基と結合した基である。

[0052] 「置換基を有するカルボキシル基」としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、i-ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、n-ペンチルオキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基などのアルコキシカルボニル基、好ましくはC 1~6アルコキシカルボニル基；

ビニルオキシカルボニル基、アリルオキシカルボニル基などのアルケニルオキシカルボニル基、好ましくはC 2～6アルケニルオキシカルボニル基；

エチニルオキシカルボニル基、プロパルギルオキシカルボニル基などのアルキニルオキシカルボニル基、好ましくはC 2～6アルキニルオキシカルボニル基；

フェノキシカルボニル基、ナフトキシカルボニル基などのアリールオキシカルボニル基、好ましくはC 6～10アリールオキシカルボニル基；

ベンジルオキシカルボニル基などのアラルキルオキシカルボニル基、好ましくはC 6～10アリールC 1～6アルコキシカルボニル基；などが挙げられる。

[0053] 「置換基を有するカルバモイル基」は、C 1～6アルキル基、C 2～6アルケニル基、C 2～6アルキニル基、C 6～10アリール基、C 6～10アリールC 1～6アルキル基、または5～6員ヘテロ環基が、カルバモイル基と結合した基である。

[0054] 「置換基を有するカルバモイル基」としては、メチルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、ジエチルカルバモイル基などのモノアルキルカルバモイル基またはジアルキルカルバモイル基、好ましくはモノC 1～6アルキルカルバモイル基またはジC 1～6アルキルカルバモイル基； フェニルカルバモイル基、4-メチルフェニルカルバモイル基などのモノアリールカルバモイル基、好ましくはモノC 6～10アリールカルバモイル基；などが挙げられる。

[0055] 「置換基を有する水酸基」としては、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、n-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基、デシルオキシ基、ドデシルオキシ基、ラウリルオキシ基、i-プロポキシ基、i-ブトキシ基、s-ブトキシ基、t-ブトキシ基、1-エチルプロポキシ基、i-ヘキシルオキシ基、4-メチルペントキシ基、3-メチルペントキシ基、2-メチルペントキシ基、1-メチルペントキシ基、3, 3-ジメチルブトキシ基、2, 2-ジメチルブトキシ基、1, 1-ジメチルブトキ

シ基、1, 2-ジメチルブトキシ基、1, 3-ジメチルブトキシ基、2, 3-ジメチルブトキシ基、1-エチルブトキシ基、2-エチルブトキシ基などのアルコキシ基、好ましくはC 1~6アルコキシ基；

[0056] シクロプロピルメチルオキシ基、2-シクロペンチルエチルオキシ基などのシクロアルキルアルコキシ基、好ましくはC 3~8シクロアルキルC 1~6アルコキシ基； ベンジルオキシ基などのアラルキルオキシ基、好ましくはC 6~10アリールC 1~6アルコキシ基； クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、1-フルオロエトキシ基、1, 1-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基などのハロアルコキシ基、好ましくはC 1~6ハロアルコキシ基； ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、アリルオキシ基、1-ブテニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基、1-ペンテニルオキシ基、2-ペンテニルオキシ基、3-ペンテニルオキシ基、4-ペンテニルオキシ基、1-ヘキセニルオキシ基、2-ヘキセニルオキシ基、3-ヘキセニルオキシ基、4-ヘキセニルオキシ基、5-ヘキセニルオキシ基、1-メチル-2-プロペニルオキシ基、2-メチル-2-プロペニルオキシ基、1-メチル-2-ブテニルオキシ基、2-メチル-2-ブテニルオキシ基などのアルケニルオキシ基、好ましくはC 2~6アルケニルオキシ基；

[0057] エチニルオキシ基、プロピニルオキシ基、プロパルギルオキシ基、1-ブチニルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、3-ブチニルオキシ基、1-ペンチニルオキシ基、2-ペンチニルオキシ基、3-ペンチニルオキシ基、4-ペンチニルオキシ基、1-ヘキシニルオキシ基、1-メチル-2-プロピニルオキシ基、2-メチル-3-ブチニルオキシ基、1-メチル-2-ブチニルオキシ基、2-メチル-3-ペンチニルオキシ基、1, 1-ジメチル-2-ブチニルオキシ基などのアルキニルオキシ基、好ましくはC 2~6アルキニルオキシ基； シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロヘプチルオキシ基、シ

クロオクチルオキシ基、2-メチルシクロプロピルオキシ基、2-エチルシクロプロピルオキシ基、2, 3, 3-トリメチルシクロブチルオキシ基、2-メチルシクロペンチルオキシ基、2-エチルシクロヘキシルオキシ基、2-エチルシクロオクチルオキシ基、4, 4, 6, 6-テトラメチルシクロヘキシルオキシ基、1, 3-ジブチルシクロヘキシルオキシ基などのシクロアルキルオキシ基、好ましくはC 3~6シクロアルキルオキシ基； フェニルオキシ基、ナフチルオキシ基、アズレニルオキシ基、インデニルオキシ基、インダニルオキシ基、テトラリニルオキシ基などのアリールオキシ基、好ましくはC 6~10アリールオキシ基；

ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、2-ナフチルメチルオキシ基などのアリールアルキルオキシ基（アラルキルオキシ基）、好ましくはC 6~10アリールC 1~6アルキルオキシ基；

アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、n-プロピルカルボニルオキシ基、i-プロピルカルボニルオキシ基、n-ブチルカルボニルオキシ基、i-ブチルカルボニルオキシ基、ペンタノイルオキシ基、ピバロイルオキシ基などのアシルオキシ基、好ましくはC 1~7アシルオキシ基；

メトキシカルボニルメチルオキシ基、1-メトキシカルボニル-1-メチルエチルオキシ基などのアルコキシカルボニルアルキルオキシ基、好ましくはC 1~6アルコキシカルボニルC 1~6アルコキシ基；

トリメチルシリルオキシ基、t-ブチルジメチルシリルオキシ基などのトリアルキルシリルオキシ基、好ましくはトリC 1~6アルキルシリルオキシ基；

などが挙げられる。

[0058] 「置換基を有するアミノ基」としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基などのアルキルアミノ基、好ましくはモノC 1~6アルキルアミノ基またはジC 1~6アルキルアミノ基； メチリデンアミノ基、エチリデンアミノ基などのモノC 1~6アルキリデンアミノ基； フェニルアミノ基

、4-メチルフェニルアミノ基などのモノアリールアミノ基、好ましくはモノC₆~10アリールアミノ基；ジ1-ナフチルアミノ基などのジアリールアミノ基、好ましくはジC₆~10アリールアミノ基；ベンジルアミノ基などのアラルキルアミノ基、好ましくはC₆~10アリールC₁~6アルキルアミノ基；アセチルアミノ基、トリフルオロアセチルアミノ基、ベンゾイルアミノ基などのアシルアミノ基、好ましくはC₁~6アシルアミノ基；メトキシカルボニルアミノ基、t-ブトキシカルボニルアミノ基などのアルコキシカルボニルアミノ基、好ましくはC₁~6アルコキシカルボニルアミノ基；などが挙げられる。

[0059] 「置換基を有するメルカプト基」としては、メチルチオ基、エチルチオ基などのアルキルチオ基、好ましくはC₁~6アルキルチオ基；フェニルチオ基、4-メチルフェニルチオ基などのアリールチオ基、好ましくはC₆~10アリールチオ基；アセチルチオ基、ベンゾイルチオ基などのアシルチオ基、好ましくはC₁~6アシルチオ基；などが挙げられる。

[0060] 「置換基を有するスルホニル基」としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、n-プロピルスルホニル基、i-プロピルスルホニル基、n-ブチルスルホニル基、i-ブチルスルホニル基、s-ブチルスルホニル基、t-ブチルスルホニル基、n-ペンチルスルホニル基、i-ペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、1-エチルプロピルスルホニル基、n-ヘキシルスルホニル基、i-ヘキシルスルホニル基などのアルキルスルホニル基、好ましくはC₁~6アルキルスルホニル基；トリフルオロメチルスルホニル基などのハロアルキルスルホニル基、好ましくはC₁~6ハロアルキルスルホニル基；フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルスルホニル基などのアリールスルホニル基、好ましくはC₆~10アリールスルホニル基；スルフォ基；メトキシスルホニル基、エトキシスルホニル基などのアルコキシスルホニル基、好ましくはC₁~6アルコキシスルホニル基；スルファモイル基；N-メチルスルファモイル基、N-エチルスルファモイル基、N,N-ジメチルスルファモイル基、N,N-ジエチルスルファ

モイル基などのスルファモイル基、好ましくはモノ C 1 ~ 6 アルキルスルファモイル基またはジ C 1 ~ 6 アルキルスルファモイル基； フェニルスルファモイル基、4-メチルフェニルスルファモイル基などのモノアリールスルファモイル基、好ましくはモノ C 6 ~ 10 アリールスルファモイル基；などが挙げられる。

[0061] 「ハロゲノ基」としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などが挙げられる。

[0062] $CR^1R^2R^3$ で表される基の好ましい組合せとしては、以下の組合せを挙げることができる。

R^1 は、無置換の若しくは置換基を有する水酸基であり、

R^2 は、水素原子または無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 8 アルキル基であり、

R^3 は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 8 アルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 8 アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 8 アルキニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 6 ~ 10 アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 8 アシル基、無置換の若しくは置換基を有する（1-イミノ）C 1 ~ 8 アルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 8 アルコキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、またはシアノ基である。

[0063] また、以下の組合せも、好ましい例として挙げることができる。

R^1 は、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 8 アルキル基であり、

R^2 は、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 8 アルキル基であり、

R^3 は、置換基を有する C 1 ~ 8 アルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 8 アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 8 アルキニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 6 ~ 10 アリール基、無置換の若しくは置

換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アシル基、無置換の若しくは置換基を有する（1-イミノ）C 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルコキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有するスルホニル基、またはシアノ基である。

[0064] R¹とR²は一緒になって、無置換の若しくは置換基を有する5～8員環を形成してもよいし、または $O=$ 、 $R^a R^b C=$ 若しくは $R' N=$ を形成してもよい。

ここで、R^aは、水素原子または無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基を示す。R^bは、水素原子または無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基を示す。R' は、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、または無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基を示す。

R^a、R^b、およびR' における、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基は、上記R¹～R³において、例示した「C 1～8アルキル基」と同じものが挙げられる。

R' における、置換基を有する水酸基は、上記R¹～R³において、例示した「置換基を有する水酸基」と同じものが挙げられる。

[0065] R¹とR²とが一緒になって形成し得る無置換の若しくは置換基を有する5～8員環としては、シクロプロパン環、シクロブタン環、シクロペンタン環、シクロヘキサン環、シクロヘプタン環若しくはシクロオクタン環などの脂肪族炭化水素環、好ましくはC 3～8シクロアルカン環； オキシラン環、[1, 3] ジオキシラン環、ジヒドロ-2H-ピラン環、ジヒドロ-2H-チオピラン環、テトラヒドロピリジン環などの不飽和ヘテロ環、好ましくは含酸素3～5員不飽和ヘテロ環； が挙げられる。

[0066] Rにおける、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基は、上記R¹～R³において、例示した「C 6～10アリール基」と同じものが挙げられる。好ましくはフェニル基である。

[0067] [R⁴]

R⁴は、夫々独立して、無置換の若しくは置換基を有するC₁～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC₂～8アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC₃～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC₄～8シクロアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC₆～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有するC₁～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するカルボキシル基、無置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するメルカプト基、置換基を有するスルホニル基、ハロゲン基、シアノ基、またはニトロ基を示す。

R⁴が示すこれらの基としては、R¹～R³が示す基として例示したものと同一ものが挙げられる。

式(1)、(11)および(111)における、mおよびm¹は、R⁴の個数を示し、0～6のいずれかの整数である。

R⁴は、好ましくは、C₁～6アルキル基、C₁～6ハロアルキル基、C₂～6アルケニル基、C₃～8シクロアルキル基、水酸基、C₁～6アルコキシ基、またはハロゲン基が挙げられる。

[0068] [R⁵]

R⁵は、夫々独立して、無置換の若しくは置換基を有するC₁～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC₂～8アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC₃～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC₄～8シクロアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC₆～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有するC₁～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するカルボキシル基、無

置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するメルカプト基、置換基を有するスルホニル基、ハロゲノ基、シアノ基、またはニトロ基を示す。

R^5 が示すこれらの基としては、 $R^1 \sim R^3$ が示す基として例示したものと同一ものが挙げられる。

式 (I) および (II) における、 n は、 R^5 の個数を示し、 $0 \sim 5$ のいずれかの整数である。式 (III) における、 n_1 は、 R^5 の個数を示し、 $0 \sim 4$ のいずれかの整数である。

R^5 は、好ましくは、 $C_1 \sim 6$ アルキル基、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル基、 $C_6 \sim 10$ アリール $C_1 \sim 6$ アルキル基、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル基、 $C_6 \sim 10$ アリール基、 $C_1 \sim 7$ アシル基、 $C_1 \sim 6$ アルコキシカルボニル基、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ基、アミノ基、モノ $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ基、ジ $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ基、 $C_1 \sim 6$ アルコキシカルボニルアミノ基、 $C_1 \sim 6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim 6$ アルキルスルホニル基、ハロゲノ基、シアノ基、またはニトロ基が挙げられる。

[0069] $R^1 \sim R^3$ のいずれかひとつと、 R^5 のいずれかひとつとは、一緒になって、無置換の若しくは置換基を有する $5 \sim 8$ 員環を形成してもよい。

$5 \sim 8$ 員環としては、ベンゼン環などの芳香族炭化水素環； シクロペンテン環、シクロペンタジエン環、シクロヘキセン環、シクロヘプテン環、シクロオクテン環などの $C_5 \sim 8$ シクロアルケン環； などが挙げられる。

[0070] [A, D]

A は、R が $CR^1R^2R^3$ で表される基のとき、 $5 \sim 7$ 員炭化水素環または $5 \sim 7$ 員ヘテロ環を示す。

$5 \sim 7$ 員炭化水素環としては、ベンゼン環などの芳香族炭化水素環； シクロペンテン環、シクロヘキセン環、シクロヘプテン環などの $C_5 \sim 7$ シクロアルケン環； フラン環、チオフェン環、ピロール環、イミダゾール環、ピラゾール環、チアゾール環、オキサゾール環、イソオキサゾール環、ピリ

ジソ環、ピラジソ環、ピリミジソ環、ピリダジソ環、アゼピソ環、ジアゼピソ環などの芳香族５～７員ヘテロ環； ジヒドロ－２Ｈ－ピラソ環、ジヒドロ－２Ｈ－チオピラソ環、テトラヒドロピリジソ環などの不飽和５～７員ヘテロ環； などが挙げられる。これらのうち芳香族炭化水素環が好ましく、ベンゼン環がより好ましい。

Aは、Rが、無置換の若しくは置換基を有するＣ６～１０アリール基またはシアノ基のとき、ベンゼン環を表す。

すなわち、本発明に係る化合物は、化合物（II）または（III）であることが好ましい。

[0071] Dは、５～７員炭化水素環または５～７員ヘテロ環を示す。５～７員炭化水素環および５～７員ヘテロ環としては、上記Aで例示したものと同一ものが挙げられるこれらのうち芳香族炭化水素環が好ましく、ベンゼン環がより好ましい。

すなわち、本発明に係る化合物は、化合物（III）であることがより好ましい。

[0072] [X, Y, Z]

Xは、酸素原子、硫黄原子、スルフェニル基、スルホニル基、無置換の若しくは置換基を有する炭素原子、または無置換の若しくは置換基を有する窒素原子を示す。

炭素原子の置換基としては、オキソ基、Ｃ２～６アルケニルイミノ基、または水酸基が挙げられる。

[0073] Yは、炭素原子、または窒素原子を示す。Zは、炭素原子、または窒素原子を示す。YおよびZが、共に炭素原子で、DがYおよびZを含んだ芳香族子を示す。

炭化水素環となることが好ましい。

[0074] 本発明化合物の塩若しくはN－オキサイド化合物としては、農園芸学的に許容される塩若しくはN－オキサイド化合物であれば、特に制限されない。

塩としては、例えば、塩酸、硫酸などの無機酸の塩；酢酸、乳酸などの有機酸の塩；リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属の塩；カルシ

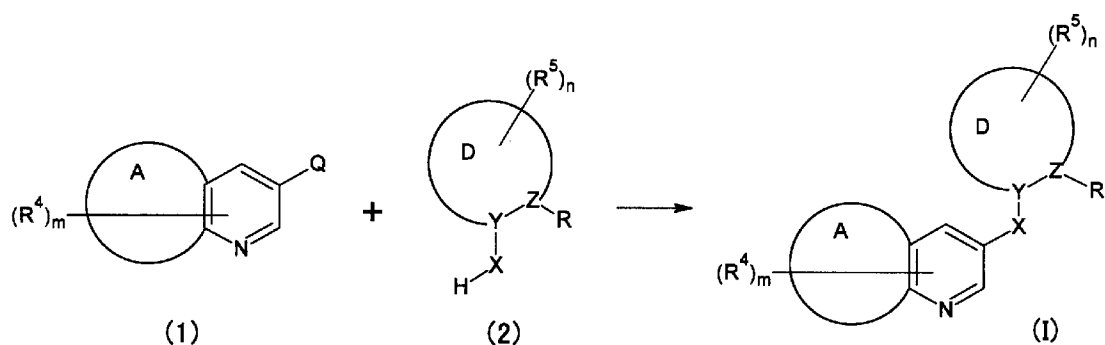
ウム、マグネシウムなどのアルカリ土類金属の塩；鉄、銅などの遷移金属の塩；アンモニア、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ヒドラジンなどの有機塩基の塩などが挙げられる。

[0075] (本発明化合物の製造方法)

本発明の化合物は、例えば、以下に示す合成方法によって製造することができる。

(合成方法 1)

[0076] [化4]



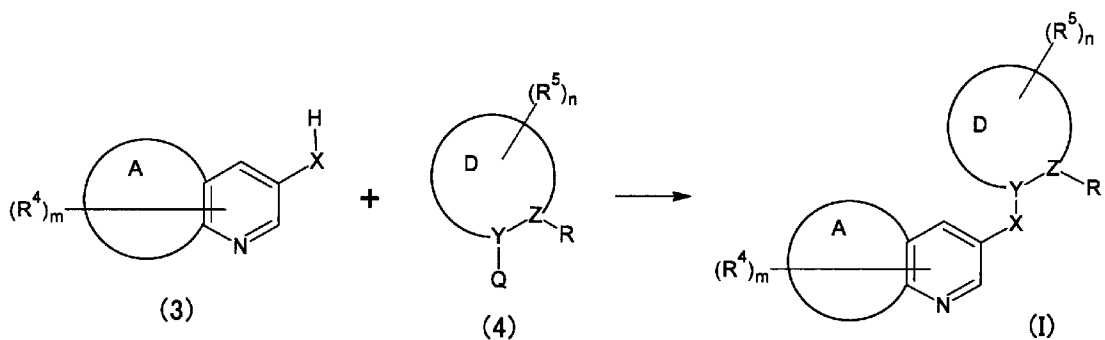
(式中、R、R⁴、R⁵、A、D、X、Y、Z、m及びnは前記と同じ意味を表す。Qはハロゲン原子を表す。)

式(1)で表される化合物と式(2)で表される化合物とを公知の方法によって反応させて式(I)で表される化合物を製造することができる。

本発明においては、7, 8-ジフルオロ-3-ヨードキノリンが、有用な製造中間体である。

[0077] (合成方法 2)

[0078] [化5]



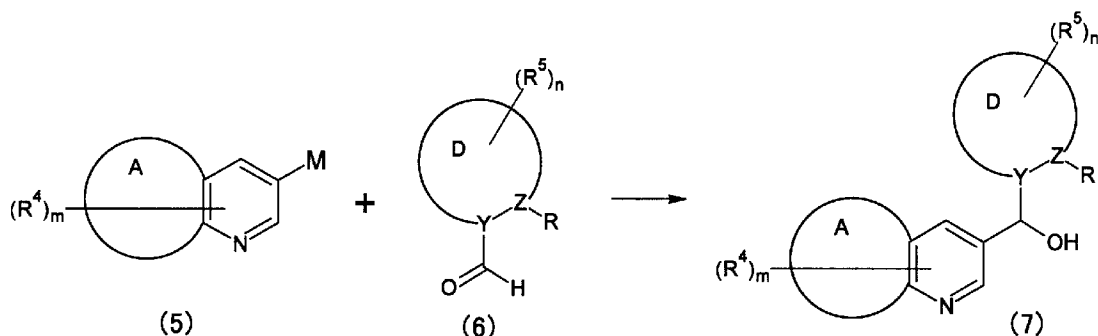
(式中、 R 、 R^4 、 R^5 、 A 、 D 、 Q 、 X 、 Y 、 Z 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。)

式(3)で表される化合物と式(4)で表される化合物とを公知の方法によって反応させて式(I)で表される化合物を製造することができる。

本発明においては、8-フルオロ-3-ヒドロキシキノリン、7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシキノリン、8-フルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリン、または7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリンが、有用な製造中間体である。

[0079] (合成方法3)

[0080] [化6]



(式中、 R 、 R^4 、 R^5 、 A 、 D 、 X 、 Y 、 Z 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。 M はリチウムまたはマグネシウムを表す。)

アルキルリチウム試薬やグリニャール試薬あるいはアルキルリチウム試薬とグリニャール試薬から調製されるアート型錯体を用いてリチオ化あるいはマグネシウム錯体化して式(5)で表される化合物を得、次いで式(6)で表される化合物を添加して、式(7)で表される化合物を製造する。

リチオ化に用いられるアルキルリチウム試薬としては、メチルリチウム、 n -ブチルリチウム、 s -ブチルリチウム、 t -ブチルリチウムなどが挙げられる。

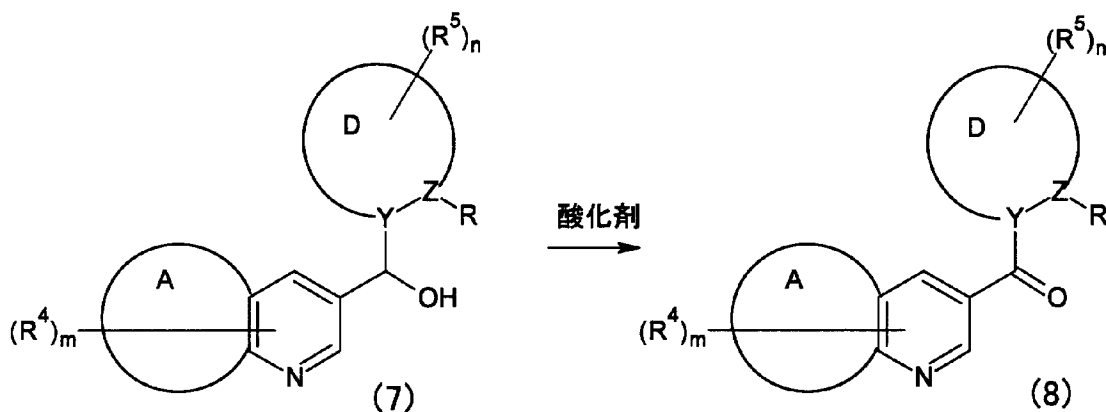
マグネシウム錯体化に用いられるグリニャール試薬としては、メチルマグネシウムクロライド、エチルマグネシウムクロライド、 n -ブチルマグネシウムクロライド、 i -プロピルマグネシウムクロライドなどが挙げられる。

また、例えば n -ブチルマグネシウムクロライドと n -ブチルリチウムから調製されるアート型錯体も用いることができる。

リチオ化またはマグネシウム錯体化において用いられる溶媒としては、無水の反応系を構成でき、用いる化合物を溶解し、反応あるいは何らかの特段の相互作用をしないものであれば特に制限されない。好適な例としては、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、アイソパー（登録商標）E、アイソパー（登録商標）Gなどのアルカン系、ベンゼン、トルエン、オルトキシレンなどの芳香族系、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル系溶媒、およびこれら溶媒の混合液が挙げられる。これらのうち、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル系溶媒が好ましい。反応時は窒素雰囲気下などで無水系とし、 -10°C ～ -78°C の温度において調製することができる。

[0081]（合成方法4）

[0082] [化7]

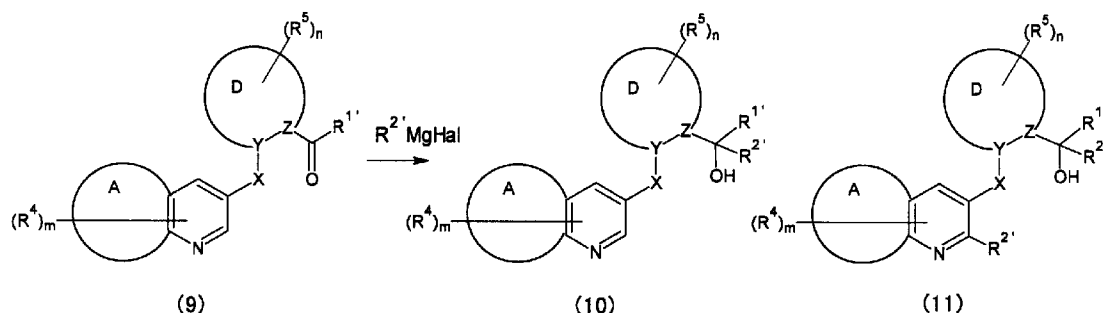


（式中、 R 、 R^4 、 R^5 、 A 、 D 、 Y 、 Z 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。）

式（7）で表される化合物に酸化剤を作用させて酸化することによって式（8）で表される化合物を製造する。該酸化反応は、2級水酸基を酸化できる反応であれば、特に限定することなく行うことができる。例えば、Jones酸化、オゾン酸化、Swern酸化などの酸化法、または二酸化マンガン、デス・マーチン試薬などの酸化試薬を用いる方法が挙げられる。

[0083] (合成方法 5)

[0084] [化8]

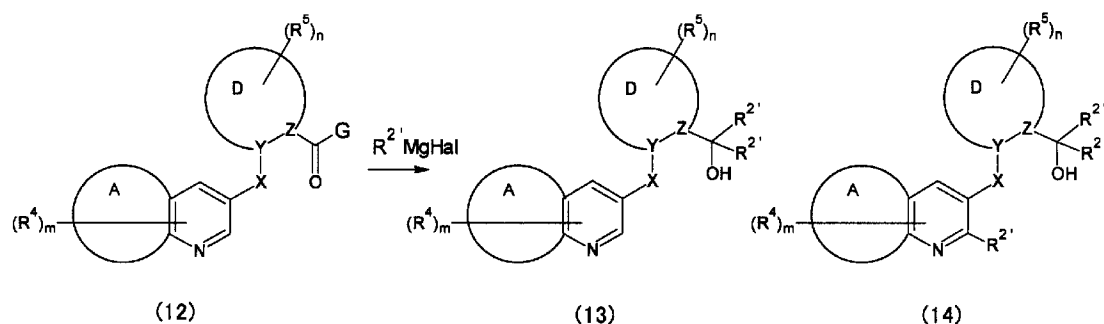


(式中、 R^4 、 R^5 、A、D、X、Y、Z、m及びnは前記と同じ意味を表す。 $R^{1'}$ 、 $R^{2'}$ は前記の $R^1 \sim R^3$ のうち無置換の若しくは置換基を有するアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するアルキニル基、無置換の若しくは置換基を有するアリール基、または無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環を表す。Halは、ハロゲン原子を表す。)

式(9)で表される化合物に1当量のグリニャール試薬を反応させることによって式(10)で表される化合物を製造できる。また、式(9)で表される化合物に2当量以上のグリニャール試薬を反応させることによって式(11)で表される化合物を製造できる。

[0085] (合成方法 6)

[0086] [化9]



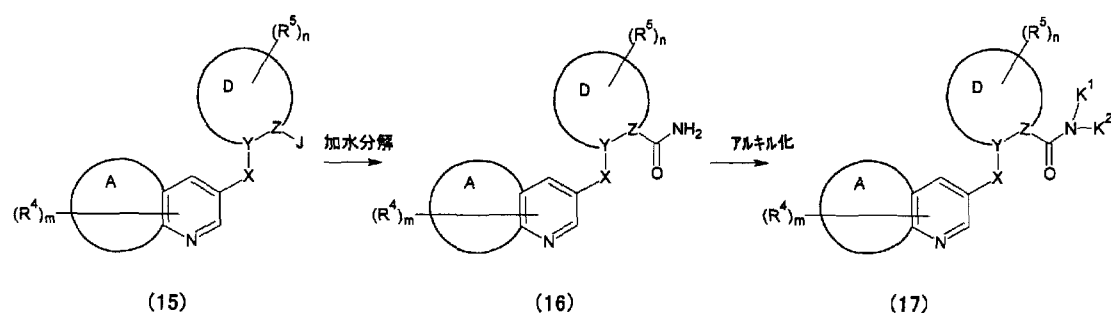
[0087] (式中、 R^4 、 R^5 、 $R^{2'}$ 、A、D、X、Y、Z、m、n及びHalは前記と同じ意味を表す。Gはアルコキシ基、ハロゲン原子などの脱離基を表す。)

式(12)で表される化合物に1当量のグリニャール試薬を反応させることに

よって式(13)で表される化合物を製造できる。また、式(12)で表される化合物に2当量以上のグリニャール試薬を反応させることによって式(14)で表される化合物を製造できる。

[0088] (合成方法7)

[0089] [化10]



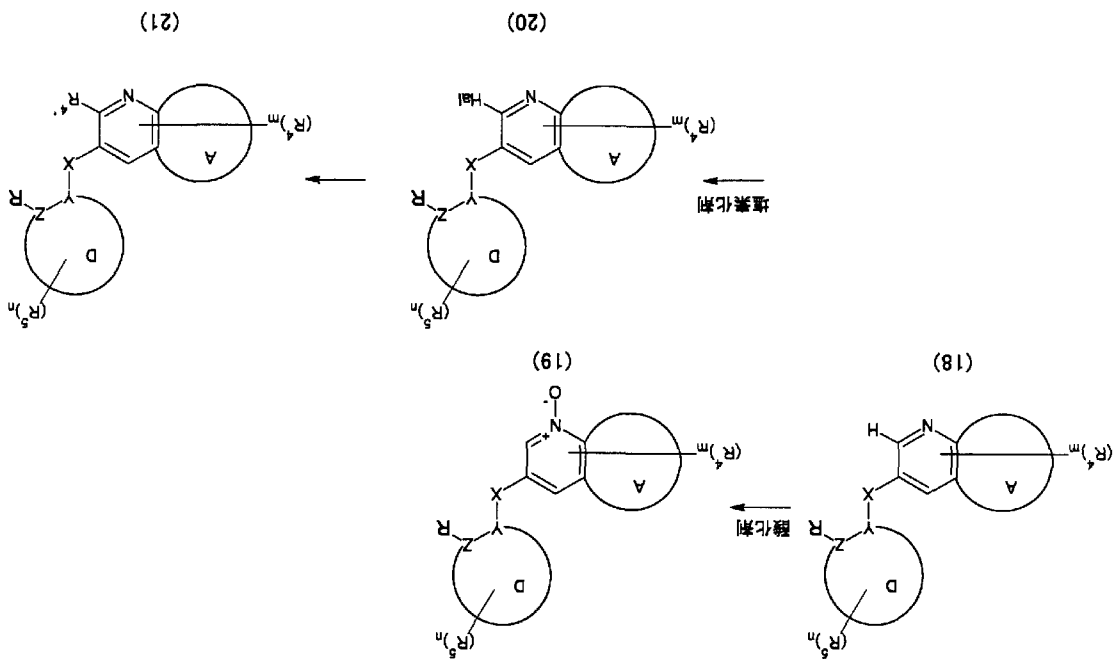
(式中、 R^4 、 R^5 、 A 、 D 、 X 、 Y 、 Z 、 m 及び n は前記と同じ意味を表す。
 J はアルコキシカルボニル基またはシアノ基を表す。 K^1 及び K^2 は、アルキル基を表す。)

既知の方法で加水分解することによって式(16)で表されるアミド化合物を製造することができる。さらに塩基の存在下にアルキル化剤を作用させることによって式(17)で表される化合物を合成できる。

[0090] (合成方法8)

[0091]

[化11]



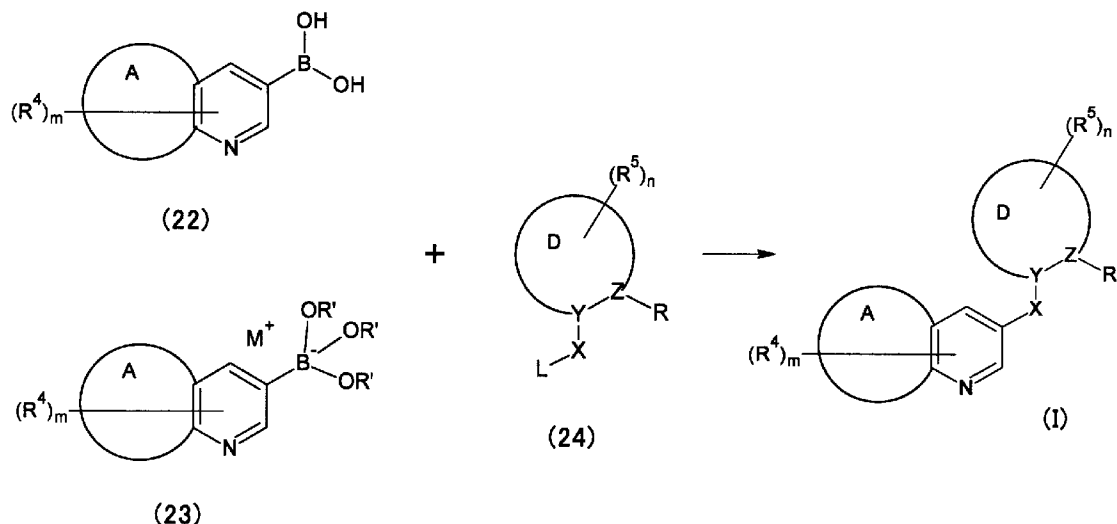
(式中、R、R⁴、R⁵、A、D、X、Y、Z、m、n 及び Hal は前記と同じ意味を表す。R⁴ は無置換の若しくは置換基を有するアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するアリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、または無置換の若しくは置換基を有するチオアルキル基を表す。)

式 (18) で表される化合物を酸化剤などの公知の方法を用いて酸化させることによって式 (19) で表される N-オキソド化合物を製造することができる。これに、オキシ塩化リンなどの公知のハロゲン化剤を作用させることによって式 (20) で表される化合物を製造できる。そして、これを、求核置換反応や有機金属触媒を用いるカップリング反応させることによって式 (21) で表される化合物を合成できる。

[0092] (合成方法 9)

[0093]

[化12]



(式中、 R 、 R^4 、 R^5 、 A 、 D 、 X 、 Y 、 Z 、 m および n は前記と同じ意味を表す。 R' はC 1～8アルキル基を表す。 M は、リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属を表す。 L はハロゲン原子である。)

式(22)若しくは式(23)で表されるボロン酸誘導体と式(24)で表されるハライド誘導体とをSuzukiカップリング反応させることによって式(I)で表される化合物を調製することができる。

[0094] N-オキサイド化合物は、既知の酸化反応によって調製することができる。例えば、溶媒中または無溶媒において、式(I)で表される化合物と、過酸化水素などの過酸化剤とを接触させることによって調製することができる。

[0095] いずれの反応においても、反応終了後は、有機合成化学における通常の後処理操作、および、必要により従来公知の分離精製手段を施すことによって、目的物を効率よく単離することができる。

[0096] 目的物の構造は、 1H -NMRスペクトル、IRスペクトル、マスマスペクトルの測定や、元素分析などにより、同定・確認することができる。

[0097] 2) 農園芸用殺菌剤

本発明に係る農園芸用殺菌剤は、本発明に係る式(I)で表される含窒素ヘテロ環化合物およびその塩若しくはN-オキサイド化合物から選ばれる少

なくとも1種を有効成分として含有するものである。

[0098] 本発明の殺菌剤は、広範囲の種類の糸状菌、例えば、藻菌類 (Oomycetes)、子のう (嚢) 菌類 (Ascomycetes)、不完全菌類 (Deuteromycetes)、担子菌類 (Basidiomycetes) に属する菌に対し優れた殺菌力を有する。

[0099] 本発明の殺菌剤は、花卉、芝、牧草を含む農園芸作物の栽培に際し発生する種々の病害の防除に、種子処理、茎葉散布、土壌施用または水面施用などにより使用することができる。

[0100] 例えば、

テンサイ：褐斑病 (*Cercospora beticola*)、黒根病 (*Aphanomyces cochlioides*)、根腐病 (*Thanatephorus cucumeris*)、葉腐病 (*Thanatephorus cucumeris*) ;

ラッカセイ：褐斑病 (*Mycosphaerella arachidis*)、黒渋病 (*Mycosphaerella berkeleyi*) ;

キュウリ：うどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea*)、べと病 (*Pseudoperonospora cubensis*)、つる枯病 (*Mycosphaerella melonis*)、つる割病 (*Fusarium oxysporum*)、菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*)、灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、炭そ病 (*Colletotrichum orbiculare*)、黒星病 (*Cladosporium cucumerinum*)、褐斑病 (*Corynespora cassicola*)、苗立枯病 (*Pythium debaryanum*、*Rhizoctonia solani* Kuhn)、斑点細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *Lecrymans*) ;

トマト：灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、葉かび病 (*Cladosporium fulvum*)、疫病 (*Phytophthora infestans*) ;

ナス：灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、黒枯病 (*Corynespora melongenae*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、すすかび病 (*Mycovellosiella nattrassii*) ;

イチゴ：灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*)、炭そ病 (*Colletotrichum acutatum*、*Colletotrichum fragariae*)、疫病 (*Phytophthora cactorum*) ;

タマネギ：灰色腐敗病 (*Botrytis allii*)、灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)

、白斑葉枯病(*Botrytis squamosa*)、べと病(*Peronospora destructor*) ;

キャベツ : 根こぶ病(*Plasmodiophora brassicae*)、軟腐病(*Erwinia caroto vora*)、べと病(*Peronospora parasitica*) ;

インゲン : 菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、灰色かび病(*Botrytis cinerea*) ;

りんご : うどんこ病(*Podosphaera leucotricha*)、黒星病(*Venturia inaequalis*)、モニリア病(*Monilinia mali*)、黒点病(*Mycosphaerella pomi*)、腐らん病(*Valsa mali*)、斑点落葉病(*Alternaria mali*)、赤星病(*Gymnosporangium yamadae*)、輪紋病(*Botryosphaeria berengeriana*)、炭そ病(*Glomerella cingulata*、*Colletotrichum acutatum*)、褐斑病(*Diplocarpon mali*)、すす点病(*Zygophiala jamaicensis*)、すす斑病(*Gloeodes pomigena*) ;

カキ : うどんこ病(*Phyllactinia kakicola*)、炭そ病(*Gloeosporium kaki*)、角斑落葉病(*Cercospora kaki*) ;

[0101] モモ : 灰星病(*Monilinia fructicola*)、黒星病(*Gladosporium carpophilum*)、ホモプシス腐敗病(*Phomopsis* sp.) ;

オウトウ : 灰星病(*Monilinia fructicola*) ;

ブドウ : 灰色かび病(*Botrytis cinerea*)、うどんこ病(*Uncinula necator*)、晩腐病(*Glomerella cingulata*、*Colletotrichum acutatum*)、べと病(*Plasmopara viticola*)、黒とう病(*Elsinoe ampelina*)、褐斑病(*Pseudocercospora vitis*)、黒腐病(*Guignardia bidwellii*) ;

ナシ : 黒星病(*Venturia nashicola*)、赤星病(*Gymnosporangium asiaticum*)、黒斑病(*Alternaria kikuchiana*)、輪紋病(*Botryosphaeria berengeriana*)、うどんこ病(*Phyllactinia mali*) ;

チャ : 輪斑病(*Pestalotia theae*)、炭そ病(*Colletotrichum theae-sinensis*) ;

カンキツ : そうか病(*Elsinoe fawcetti*)、青かび病(*Penicillium italicum*)、緑かび病(*Penicillium digitatum*)、灰色かび病(*Botrytis cinerea*)、黒点病(*Diaporthe citri*)、かいよう病(*Xanthomonas campestris* pv. *Citri*) ;

コムギ：うどんこ病(*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*)、赤かび病(*Gibberella zeae*)、赤さび病(*Puccinia recondita*)、褐色雪腐病(*Pythium iwayamai*)、紅色雪腐病(*Monographella nivalis*)、眼紋病(*Pseudocercospora herpotrichoides*)、葉枯病(*Septoria tritici*)、ふ枯病(*Leptosphaeria nodorum*)、雪腐小粒菌核病(*Typhula incarnata*)、雪腐大粒菌核病(*Myriosclerotinia borealis*)、立枯病(*Gaeumanomyces graminis*)；

[0102] オオムギ：斑葉病(*Pyrenophora graminea*)、雲形病(*Rhynchosporium secalis*)、裸黒穂病(*Ustilago tritici*、*U. nuda*)；

イネ：いもち病(*Pyricularia oryzae*)、紋枯病(*Rhizoctonia solani*)、馬鹿苗病(*Gibberella fujikuroi*)、ごま葉枯病(*Cochliobolus niyabeanus*)、苗立枯病(*Pythium graminicolum*)、白葉枯病(*Xanthomonas oryzae*)、苗立枯細菌病(*Burkholderia plantarii*)、褐条病(*Acidovorax avenae*)、もみ枯細菌病(*Burkholderia glumae*)；

タバコ：菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)、うどんこ病(*Erysiphe cichoracearum*)；

チューリップ：灰色かび病(*Botrytis cinerea*)；

ベントグラス：雪腐大粒菌核病(*Sclerotinia borealis*)、赤焼病(*Pythium aphanidermatum*)；

オーチャードグラス：うどんこ病(*Erysiphe graminis*)；

ダイズ：紫斑病(*Cercospora kikuchii*)、べと病(*Peronospora manshurica*)、茎疫病(*Phytophthora sojae*)；

ジャガイモ・トマト：疫病(*Phytophthora infestans*)；

などの防除に使用することができる。

[0103] また、本発明の殺菌剤は、耐性菌に対しても優れた殺菌効果を有する。耐性菌としては、チオファネートメチル、ベノミル、カルベンダジムなどのベンズイミダゾール系殺菌剤に耐性を示す灰色かび病菌 (*Botrytis cinerea*) やテンサイ褐斑病菌 (*Cercospora beticola*)、リンゴ黒星病菌 (*Venturia inaequalis*)、ナシ黒星病菌 (*Venturia nashicola*)；ジカルボキシイミド系

殺菌剤（例えば、ビンクロゾリン、プロシミドン、イプロジオン）に耐性を示す灰色かび病菌（*Botrytis cinerea*）などが挙げられる。

[0104] 本発明の殺菌剤の適用がより好ましい病害としては、リンゴの黒星病、キュウリの灰色かび病、コムギのうどんこ病、トマトの疫病、コムギの赤さび病、水稻のいもち病、キュウリのつる割病などが挙げられる。

[0105] また、本発明の殺菌剤は薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低く、安全性の高い薬剤である。

本発明の殺菌剤は、農薬としてとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤などの農薬製剤の形態で 사용할ことができる。

[0106] 固体の製剤に用いられる添加剤および担体としては、大豆粉、小麦粉などの植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレーなどの鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝などの有機および無機化合物などが挙げられる。

[0107] 液体の製剤に用いられる溶剤としては、ケロシン、キシレンおよび石油系の芳香族炭化水素、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、トリクロロエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水などが挙げられる。

[0108] さらに、これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要に応じ界面活性剤を添加することができる。

添加することができる界面活性剤は特に限定されない。例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテルなどの非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、高級アルコールの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスル

ホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレンー無水マレイン酸共重合体などが挙げられる。

[0109] このようにして得られた水和剤、乳剤、フロアブル剤、水溶剤、若しくは顆粒水和剤は水で所定の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液として植物に散布する方法で使用される。また、粉剤・粒剤はそのまま植物に散布する方法で使用される。

[0110] 本発明の殺菌剤中における有効成分量は、通常、製剤全体に対して、好ましくは0.01～90重量%、より好ましくは0.05～85重量%である。

[0111] 本発明の殺菌剤の施用量は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用方法、施用場所、防除対象病害、対象作物などにより異なるが、通常1ヘクタール当たり有効成分化合物量にして1～1,000g、好ましくは10～100gである。

[0112] 水和剤、乳剤、懸濁剤、水溶剤、顆粒水和剤などを水で希釈して施用する場合、その施用濃度は1～1000ppm、好ましくは10～250ppmである。

[0113] 本発明の殺菌剤には、他の殺菌剤や殺虫・殺ダニ剤、共力剤を混合することができる。

混合して使用できる他の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、植物生長調節剤の代表例を以下に示す。

殺菌剤：

ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオファネートメチルなどのベンゾイミダゾール系；

クロゾリネート、イプロジオン、プロシミドン、ビクロゾリンなどのジカルボキシイミド系；

イマザリル、オキシポコナゾール、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール、トリホリン、ピリフェノックス、フェナリモル、ヌアリモル、アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミペンコナゾール、イプコナゾール、メトコナゾール、ミク

ロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、エタコナゾール、ファーコナゾールシス、イプコナゾール、イミベンコナゾール、などのDMI-殺菌剤；

ベナラキシル、フララキシル、メタラキシル、メタラキシル-M、オキサジキシル、オフラセなどのフェニルアミド系；

アルジモルフ、ドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、ピペラリン、スピロキサミンなどのアミン系；

EDDP、イプロベンホス、ピラゾホスなどのホスホロチオレート系；

イソプロチオランなどのジチオラン系；

ベノダニル、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラン、フルトラニル、フラメトピル、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンチオピラド、チフルザミドなどのカルボキサミド；

ブピリメート、ジメチリモル、エチリモルなどのヒドロキシー（2-アミノ）ピリミジン；

[0114] シプロジニル、メパニピリム、ピリメタニルなどのAP殺菌剤（アニリノピリミジン）；

ジエトフェンカルブなどのN-フェニルカーバメート；アゾキシストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、クレソキシム-メチル、トリフロキシストロビン、ジモキシストロビン、メトミノストロビン、オリザストロビン、ファモキサドン、フルオキサストロビン、フェンアミドン、メトミノフェン、ピリベンカルブなどのQoI-殺菌剤（Qo阻害剤）；

フェンピコニル、フルジオキソニルなどのPP殺菌剤（フェニルピロール）；

キノキシフェンなどのキノリン系；

ビフェニル、クロロネブ、ジクロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクトフォス-メチルなどのAH殺菌剤（芳香族炭化水素）；

フサライド、ピロキロン、トリシクラゾールなどのMBI-R；

カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニルなどのMBI-D；
フェンヘキサミド、ピリブチカルブ、タービナフィンなどのSBI剤；
ペンシクロンなどのフェニルウレア；
シアゾファミドなどのQiIー殺菌剤（Qi阻害剤）；
ゾキサミドなどのベンズアミド；
ブラストサイジン、ミルディオマイシンなどのエノピランウロン；
カスガマイシンなどのヘキソピラノシル；
ストレプトマイシン、バリダマイシンなどのグルコピラノシル；
シモキサニルなどのシアノアセトアミド；
プロパモカルブ、プロチオカルブ、ポリカーバメートなどのカーバメート
；
ビナパクリル、ジノカップ、フェリムゾン、フルアジナムなどの脱共役剤
；
酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズ、水酸化トリフェニルスズ
などの有機スズ化合物；

- [0115] 亜リン酸、トルクロホスメチル、ホセチルなどのリン酸エステル；
テクロフタラムなどのフタルアミド酸；
トリアゾキシドなどのベンゾトリアジン；
フルスルファミドなどのベンゼンスルフォナミド；
ジクロメジンなどのピリダジノン；
ジメトモルフ、フルモルフ、ベンチアバリカルブ、イプロバリカルブ、マ
ンジプロパミドなどのCAA殺菌剤（カルボン酸アミド）；
オキシテトラサイクリンなどのテトラサイクリン；
メタスルホカルブなどのチオカーバメート；
エトリジアゾール、ポリオキシシン、オキシリニック酸、ヒドロキシイソキ
サゾール、オクチノリン、シルチオフアム、ジフルメトリム、アシベンゾラ
ルSメチル、プロベナゾール、チアジニル、エタボキサム、シフルフェナミ
ド、プロキナジド、メトラフェノン、フルオピコリド、水酸化第二銅、有機

銅、硫黄、ファーバム、マンゼブ、マンネブ、メチラム、プロピネブ、チウラム、ジネブ、ジラム、キャプタン、カプタホール、フォルペット、クロロタロニル、ジクロフルアニド、トリルフルアニド、ドジン、グアザチン、イミノクタジン、アニラジン、ジチアノン、クロロピクリン、ダゾメット、メタムナトリウム塩、キノメチオネート、シプロフラム、シルチオフアム、アグロバクテリウム、フルオルイミドなどのその他の化合物。

[0116] 殺虫・殺ダニ剤：

有機燐およびカーバメート系殺虫剤：

フェンチオン、フェニトロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、ESP、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロルホン、チオメトン、ホスメット、ジクロルボス、アセフェート、E PBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロパホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロポキスル、BPMC、MTMC、MIPG、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフエンカルブ、フェノキシカルブ、EDDPなど。

ピレスロイド系殺虫剤：

ペルメトリン、シペルメトリン、デルタメスリン、フェンバレレート、フェンプロパトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロパスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロクス、シクロプロトリン、トラロメトリン、シラフルオフエン、ブロフェンプロクス、アクリナスリンなど。

ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：

ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルム

ロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトプレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、アセタミプリド、イミダクロプリド、ニテンピラム、フィプロニル、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、BTや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬など。

[0117] 殺線虫剤：

フェナミホス、ホスチアゼートなど。

殺ダニ剤：

クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、BPP S、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネート、GPCBS、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロルなど。

植物生長調節剤：

アブシジン酸、インドール酪酸、ウニコナゾール、エチクロゼート、エテホン、クロキシホナック、クロルメコート、クロレラ抽出液、過酸化カルシウム、シアナミド、ジクロルプロップ、ジベレリン、ダミノジッド、デシルアルコール、トリネキサパックエチル、メピコートクロリド、パクロブトラゾール、パラフィン、ワックス、ピペロニルブトキシド、ピラフルフェンエチル、フルルプリミドール、プロヒドロジャスモン、プロヘキサジオンカルシウム塩、ベンジルアミノプリン、ペンディメタリン、ホルクロルフェニユロン、マレイン酸ヒドラジドカリウム、1-ナフチルアセトアミド、4-CPA、MCPB、コリン、硫酸オキシキノリン、エチクロゼート、ブトルアリン、1-メチルシクロプロペン、アビグリシン塩酸塩。

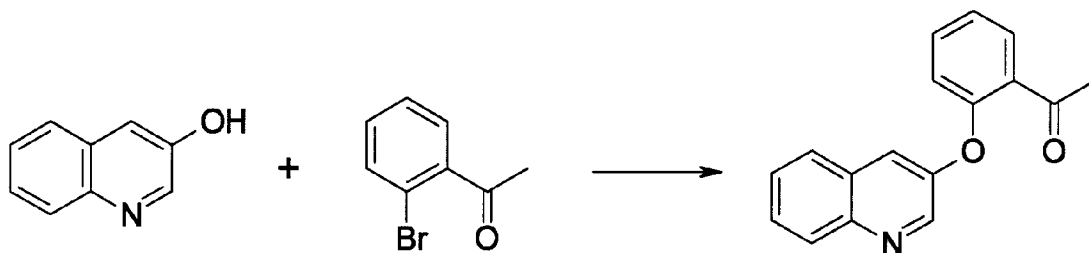
実施例

[0118] 次に、実施例を挙げて本発明を更に詳細に説明するが、本発明は以下の実施例により何ら限定されることはない。

[0119] 実施例 1

1- [2- (キノリン-3-イルオキシ) -フェニル] -エタノンの合成

[0120] [化13]



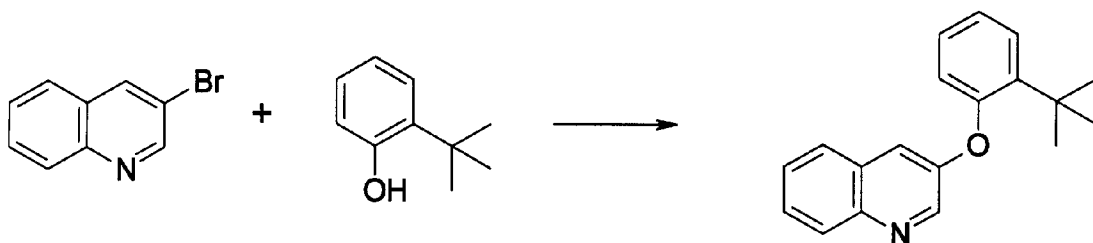
[0121] 3-キノリノール0.73g、炭酸セシウム1.8g、ジピバロイルメタン0.18g、2-ブロモアセトフェノン2.0gおよび塩化銅（I）0.50gをN-メチルピロリドン10mlに溶解し、130℃で3時間攪拌した。反応混合物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、1- [2- (キノリン-3-イルオキシ) -フェニル] -エタノン（化合物番号1）0.82gを得た。

[0122] 実施例 1 と同様の手法によって、化合物番号2～13に示す化合物を合成した。

[0123] 実施例 2

3- (2- t-ブチルフェノキシ) -キノリンの合成

[0124] [化14]



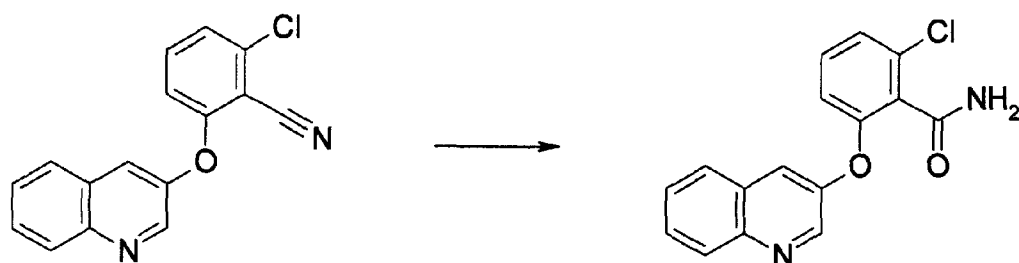
[0125] 2- t-ブチルフェノール0.60g、炭酸セシウム1.3g、ジピバロイルメタン0.07g、3-ブロモキノリン0.42gおよび塩化銅（I）0.20gをN-メチルピロリドン4mlに溶解し、130℃で1昼夜攪拌した。反応混合物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、3- (2- t-ブチルフェノキシ) -キノリン（化合物番号14）0.04gを得た。

[0126] 実施例 2 と同様の手法によって、化合物番号15～19に示す化合物を合成した。

[0127] 実施例 3

2-クロロ-6-(キノリン-3-イルオキシ)-ベンズアミドの合成

[0128] [化15]



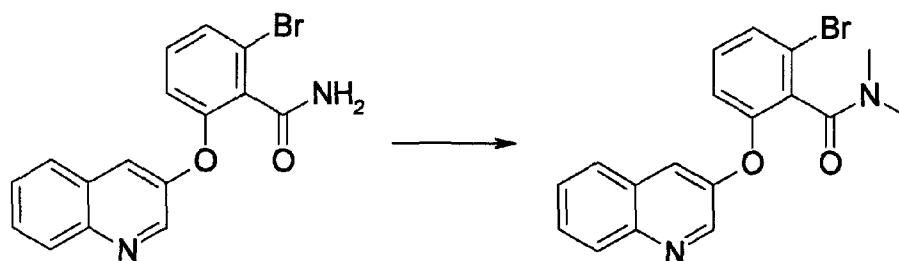
[0129] 2-クロロ-6-(キノリン-3-イルオキシ)-ベンズニトリル1.18gを80%硫酸5mlに溶解し、100℃で3時間攪拌した。水酸化ナトリウム水溶液で中和して酢酸エチルで分液後、有機層を濃縮することで、2-クロロ-6-(キノリン-3-イルオキシ)-ベンズアミド(化合物番号20)1.03gを得た。

[0130] 実施例 3 と同様の手法によって、化合物番号21に示す化合物を合成した。

[0131] 実施例 4

2-ブロモ-N,N-ジメチル-6-(キノリン-3-イルオキシ)-ベンズアミドの合成

[0132] [化16]



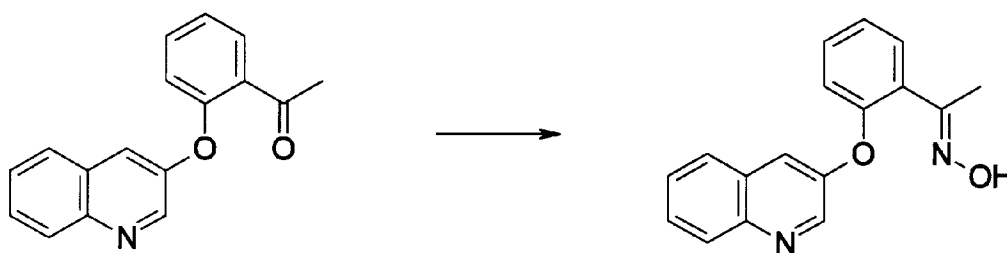
[0133] 2-ブロモ-6-(キノリン-3-イルオキシ)-ベンズアミド0.34gをN-メチルピロリドン2mlに溶解した後に、室温にて水素化ナトリウム47mgを加えた。反応溶液にヨウ化メチル0.21gを加えて100℃に加熱して4時間攪拌

した。酢酸エチルで分液後、溶媒を留去して、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで2-ブロモ-N、N-ジメチル-6-(キノリン-3-イルオキシ)-ベンズアミド(化合物番号22) 0.11gを得た。

[0134] 実施例 5

1-[2-(キノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-エタノンオキシムの合成

[0135] [化17]



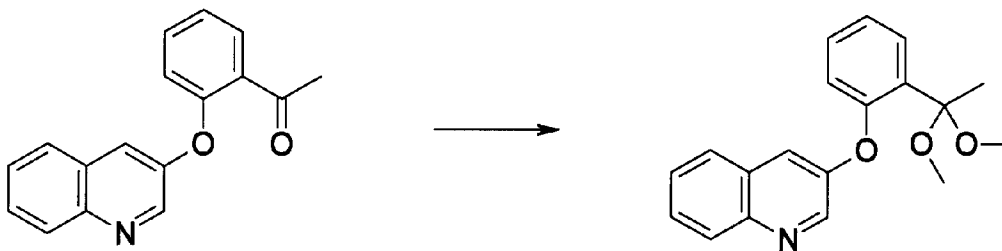
[0136] 1-[2-(キノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-エタノン0.46gとヒドロキシルアミン塩酸塩0.15gをピリジン3mlに溶解した後に室温で24時間攪拌した。反応混合物を希塩酸で処理した後に、酢酸エチルで分液して有機層を濃縮することで、1-[2-(キノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-エタノンオキシム(化合物番号23) 0.54gを得た。

[0137] 実施例 5 と同様の手法によって、化合物番号24~26に示す化合物を合成した。

[0138] 実施例 6

3-[2-(1,1-ジメトキシエチル)-フェノキシ]-キノリンの合成

[0139] [化18]

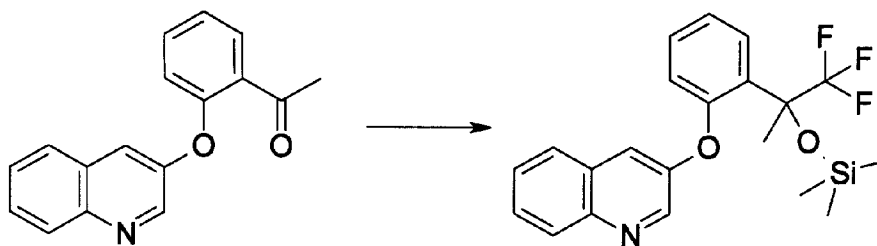


[0140] 1- [2- (キノリン-3-イルオキシ) -フェニル] -エタノン0.13gと
 オルトギ酸トリメチル0.06gをメタノール1.5mlに溶解した後、テトラブチル
 アンモニウムトリブロミド0.02gを加えて、室温で4日間攪拌した。反応混合
 物を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、
 3- [2- (1, 1-ジメトキシ-エチル) -フェノキシ] -キノリン (化
 合物番号27) 0.08gを得た。

[0141] 実施例 7

3- [2- (2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチル-1-トリメチルシ
 ラニルオキシ-エチル) -フェノキシ] -キノリンの合成

[0142] [化19]



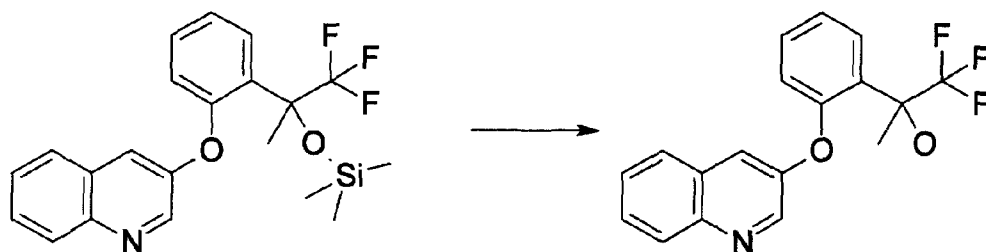
[0143] 1- [2- (キノリン-3-イルオキシ) -フェニル] -エタノン0.26gと
 (トリフルオロメチル) トリメチルシラン0.16gをテトラヒドロフラン3mlに
 溶解した後に、氷冷下にテトラブチルアンモニウムフルオリド (1.0M テト
 ラヒドロフラン溶液) 2滴を加えて、4時間攪拌した。反応混合物を濃縮し
 た後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、3- [2-
 (2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチル-1-トリメチルシラニルオキシ
 -エチル) -フェノキシ] -キノリン (化合物番号28) 0.34gを得た。

[0144] 実施例 8

1, 1, 1-トリフルオロ-2- [2- (キノリン-3-イルオキシ) -
 フェニル] -プロパン-2-オール

[0145]

[化20]

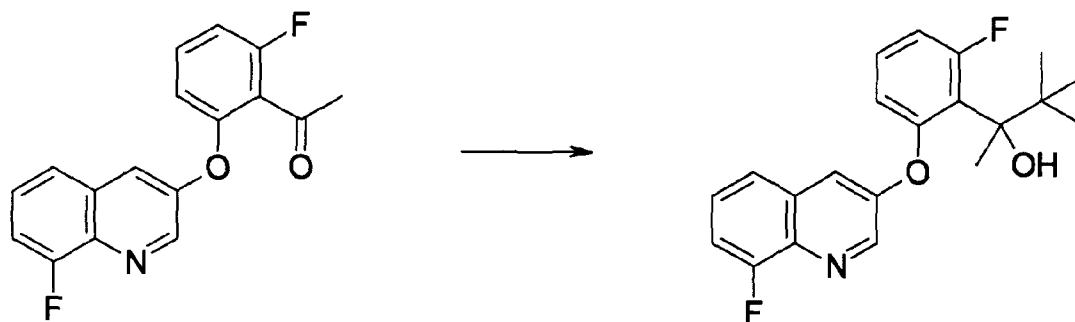


[0146] 3-〔2-〔2, 2, 2-トリフルオロー1-メチルー1-トリメチルシリルオキシ-エチル〕-フェノキシ〕-キノリン0.17gをテトラヒドロフラン1.5mlに溶解した後に、テトラブチルアンモニウムフルオリド（1.0M テトラヒドロフラン溶液）1mlを加えて16時間攪拌した。反応混合物を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、1, 1, 1-トリフルオロー2-〔2-（キノリン-3-イルオキシ）-フェニル〕-プロパン-2-オール（化合物番号29）0.11gを得た。

[0147] 実施例 9

2-〔2-フルオロー6-（8-フルオローキノリン-3-イルオキシ）-フェニル〕-3, 3-ジメチルブタン-2-オールの合成

[0148] [化21]



[0149] 1-〔2-フルオロー6-（8-フルオローキノリン-3-イルオキシ）-フェニル〕-エタノン0.15gをテトラヒドロフラン1.5mlに溶解して、-78℃に冷却した後にt-ブチルマグネシウムクロリド（2.0M ジエチルエーテル溶液）0.3mlを滴下した。室温まで反応温度を上げた後に、反応液を希塩酸で処理して、酢酸エチルで分液した。有機層を濃縮した後にシリカゲルカラム

クロマトグラフィーで精製すること、2- [2-フルオロキノリン-3-イルオキシ] フ
 ルオロキノリン-3-イルオキシ) -フェニル] -3, 3-ジメチルブタ
 シ-2-オール (化合物番号30) 0.04gを得た。

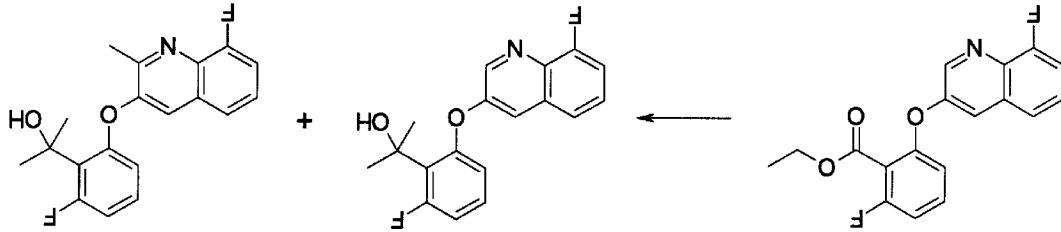
[0150] 実施例 9と同様の手法によって、化合物番号31~35に示す化合物を合成し
 た。

[0151] 実施例 10

2- [2-フルオロキノリン-6- (8-フルオロキノリン-3-イルオキシ) フ
 エニル] プロパン-2-オール、および2- [2-フルオロキノリン-6- (8-フ
 ルオロキノリン-3-イルオキシ) フェニル] プロパン-2-

オールの合成

[0152] [化22]



[0153] 2-フルオロキノリン-6- (8-フルオロキノリン-3-イルオキシ) -安息香

酸エチルエース0.3gをナトリウムプロパン-2-オールに溶解した後に、-78℃に
 冷却して、メチルマグネシウムクロリド (3.0M ジエチルエーテル溶液) 0.7
 7mlを滴下した。室温まで反応温度を上げた後に、反応液を希塩酸で処理して
 、酢酸エチルで分液した。有機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマト
 グラフィーで精製すること、2- [2-フルオロキノリン-6- (8-フルオロキノ
 リン-3-イルオキシ) フェニル] プロパン-2-オール (化合物番号36
) 0.12gと2- [2-フルオロキノリン-6- (8-フルオロキノリン-3-イルオキシ) フ
 エニル] プロパン-2-オール (化合物番号37) 0.05gを

それぞれ得た。

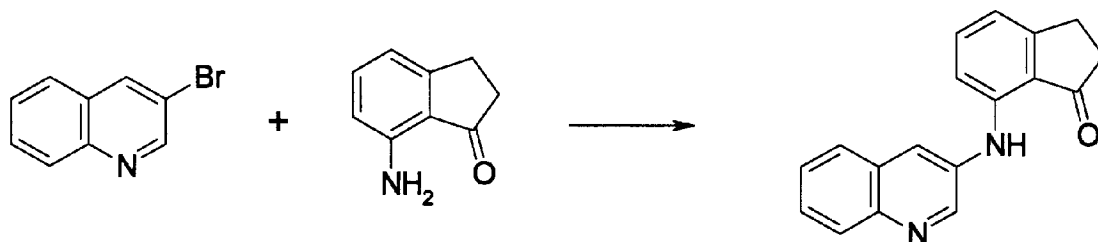
[0154] 実施例 10と同様の手法によって、化合物番号38~49に示す化合物を合成

した。

[0155] 実施例 11

7-（キノリン-3-イルアミノ）-インダン-1-オンの合成

[0156] [化23]



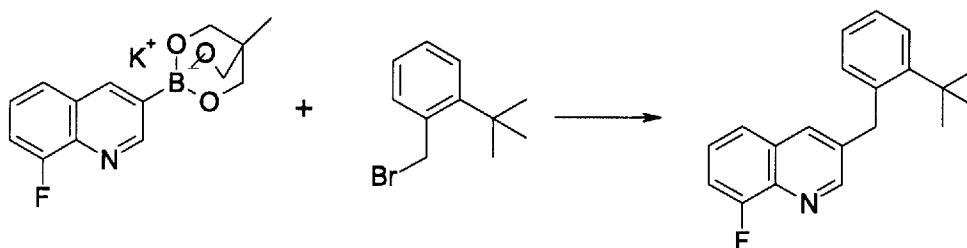
[0157] 3-ブロモキノリン0.43g、7-アミノインダン-1-オン0.29g、ヨウ化銅（I）0.08gおよび炭酸カリウム0.41gとN-メチルピロリドン4mlを混合した後に、200℃で2時間攪拌した。得られた反応混合物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、7-（キノリン-3-イルアミノ）-インダン-1-オン（化合物番号50）0.15gを得た。

[0158] 実施例11と同様の手法によって、化合物番号51に示す化合物を合成した。

[0159] 実施例12

3-（t-ブチルベンジル）-8-フルオロキノリンの合成

[0160] [化24]



[0161] 8-フルオロキノリン-3-ボロン酸と1,1,1-トリス（ヒドロキシメチル）エタンから文献（Angew. Chem. Int. Ed., 2008, 47, 928-931）に報告された方法により誘導されるトリオール塩0.69gと1-ブromoメチル-2-t-ブチルベンゼン0.45gをトルエン10mlに溶解した後に、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム0.46gを加えて、3時間攪拌した。反応混合物の溶媒を留去した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで3-（t-ブチルベンジル）-8-フルオロキノリン（化合物番号52）0

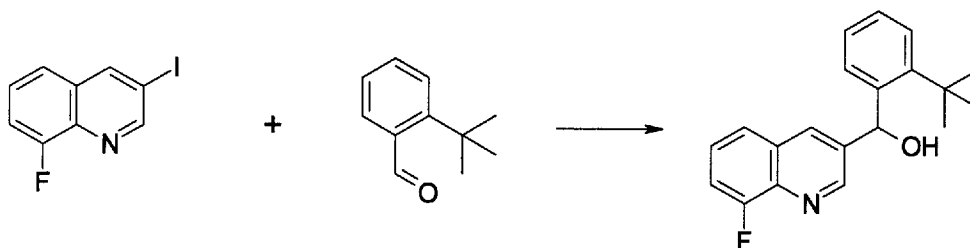
. 14gを得た。

[0162] 実施例 1 2 と同様の手法によって、化合物番号53に示す化合物を合成した。

[0163] 実施例 1 3

(2-*t*-ブチルフェニル) - (8-フルオロキノリン-3-イル) -
メタノールの合成

[0164] [化25]



[0165] テトラヒドロフラン 3ml を -10℃ に冷却した後に、*n*-ブチルリチウム (2.6M ヘキサン溶液) 0.91ml と *n*-ブチルマグネシウムクロリド (0.91M テトラヒドロフラン溶液) 1.35ml を加えた。30 分間攪拌した後に 8-フルオロ-3-ヨードキノリン 0.98g を添加して、15 分間攪拌した。反応溶液に 2-*t*-ブチルベンズアルデヒド 0.49g を加えて 3 時間攪拌した。反応混合物に希塩酸を加えた後に、酢酸エチルで分液した。有機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、(2-*t*-ブチルフェニル) - (8-フルオロキノリン-3-イル) - メタノール (化合物番号54) 0.55g を得た。

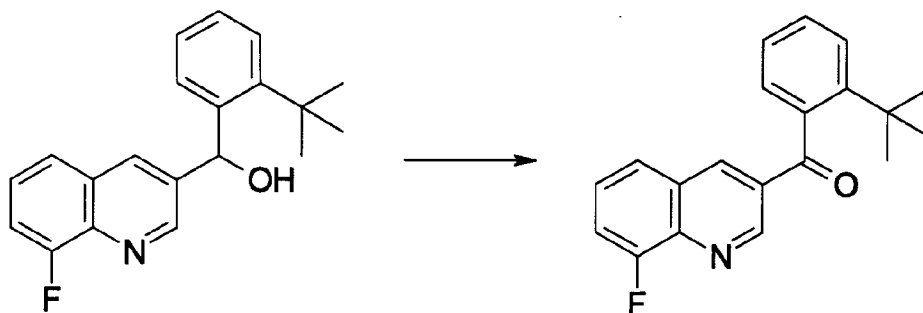
[0166] 実施例 1 3 と同様の手法によって、化合物番号55~56に示す化合物を合成した。

[0167] 実施例 1 4

(2-*t*-ブチルフェニル) - (8-フルオロキノリン-3-イル) -
メタノンの合成

[0168]

[化26]



[0169] (2-*t*-ブチルフェニル)-(8-フルオロキノリン-3-イル)メタノール0.32gをジクロロメタン3mlに溶解した後に、室温にてDess-Martin試薬0.51gを加えて1時間攪拌した。水を加えて酢酸エチルで分液後、有機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで(2-*t*-ブチルフェニル)-(8-フルオロキノリン-3-イル)メタノン(化合物番号57)0.21gを得た。

[0170] 実施例14と同様の手法によって、化合物番号58~59に示す化合物を合成した。

[0171] 実施例15

2-クロロ-3-(1,1-ジメチルインダネ-7-イルオキシ)キノリンの合成

3-(1,1-ジメチルインダネ-7-イルオキシ)キノリン0.2gを5mLのクロロホルムに溶解し、*m*-CPBA(70%)0.2gを加え室温で一晩攪拌した。反応溶液をクロロホルムで希釈した後、飽和重曹水で洗浄し、硫酸マグネシウムを加え乾燥した。溶媒を減圧下留去し、3-(1,1-ジメチルインダネ-7-イルオキシ)キノリン-N-オキサイド0.2gを得た。

このものをオキシ塩化リンに溶解し、4時間加熱還流を行った。減圧下オキシ塩化リンを留去し、残渣を酢酸エチルに溶かし、飽和重曹水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧留去した。得られた粗生成物をカラムシリカゲルクロマトグラフィーにより精製を行い、2-クロロ-3-(1,1-ジメチルインダネ-7-イルオキシ)キノリン(化合物番号60)0

. 13gを得た。

[0172] 実施例 15 と同様の手法によって、化合物番号61に示す化合物を合成した。

[0173] 実施例 16

3-（2-シアノフェノキシ）キノリンの合成

3-ヒドロキシキノリン0.27gをN-メチル-2-ピロリドンに溶解し、氷冷下で水素化ナトリウム（60%オイルディスパーション）0.087gを加え、30分間攪拌した。同温度にて2-フルオロベンゾニトリル0.27gを加え、室温で6時間攪拌した。反応溶液を氷水に加え、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去後、粗生成物をカラムシリカゲルクロマトグラフィーにて精製し、3-（2-シアノフェノキシ）キノリン（化合物番号62）0.37gを得た。

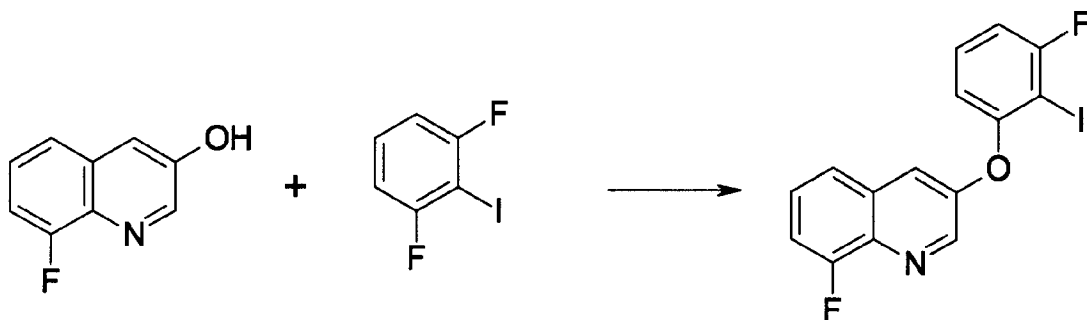
[0174] 実施例 16 と同様の手法によって、化合物番号63～66に示す化合物を合成した。

[0175] 実施例 17

ジフルオロー[2-フルオロー-6-（8-フルオロキノリン-3-イルオキシ）-酢酸エチルの合成

[0176] 工程 1) 8-フルオロー-3-（3-フルオロー-2-ヨードフェノキシ）-キノリンの合成

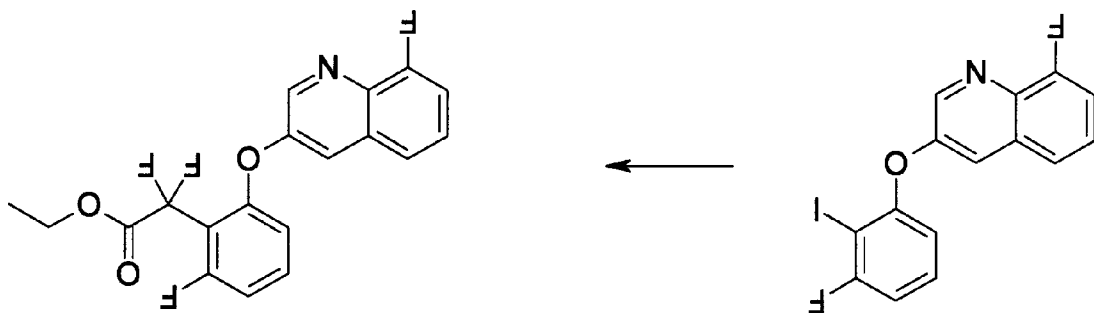
[0177] [化27]



[0178] 8-フルオロー-3-ヒドロキシキノリン1.06 g、2,6-ジフルオロヨードベンゼン1.94 g および炭酸カリウム1.7 g にN-メチルピロリドン16mlを加

えて、130°Cで24時間攪拌した。反応液をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、8-フルオロ-3-(3-フルオロ-2-ヨードフェニキシ)-1-キノリン-2-オール[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)エチル]酢酸エチルの合成

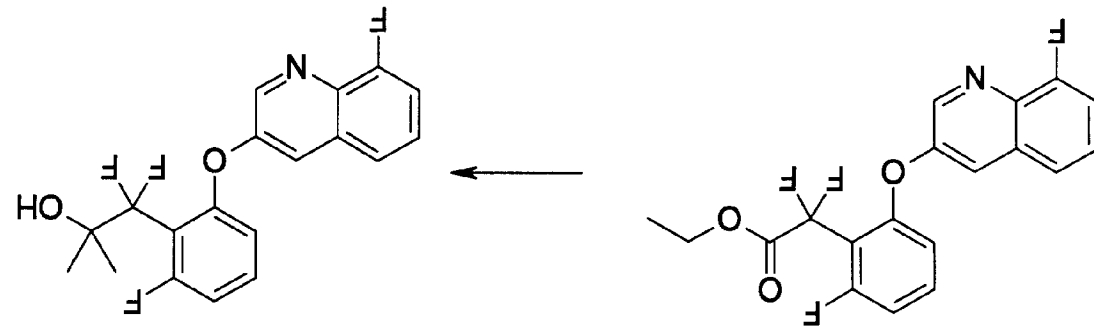
[0179] 工程2) シュルオール-2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)エチル]酢酸エチルの合成 [4k28] [0180]



[0181] 8-フルオロ-3-(3-フルオロ-2-ヨードフェニキシ)-キノリン-2-オール[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)エチル]酢酸エチルの合成 [4k29] [0183]

物番号292) 0.27 gを得た。

1, 1-シュルオール-1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)エチル]酢酸エチルの合成



[0184] シュルオール-2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)

[0189]

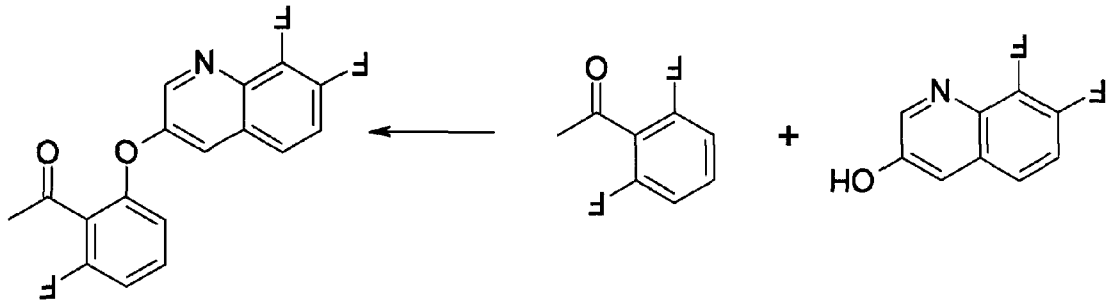
ローフエニル]ープロパシ-2-オール)の合成
2-[2-(7, 8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)-6-フルオ

[0188]

実施例 20

化合物番号391) 0.64 gを得た。

ルオロキノリン-3-イルオキシ)-6-フルオロ-フエニル]ーエタノル)
ゲルカラムクロマトグラフィーで精製すること、1-[2-(7, 8-ジフ
ルオロキノリン-3-イルオキシ)-6-フルオロ-フエニル]ーエタノル)
液に希塩酸を加えて、酢酸エチルで分液した。有機層を濃縮した後にシリカ
カラムに0.90 gを加えた。反応液を100°Cに加熱して4.5時間攪拌した。反応
ロアセトフエニル]0.94 gをジメチルホルムアミド10mlに溶解した後に、炭酸
7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシキノリン0.91 gと2, 6-ジフルオ



[0186] [化30]

ローフエニル]ーエタノル)の合成

1-[2-(7, 8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)-6-フルオ

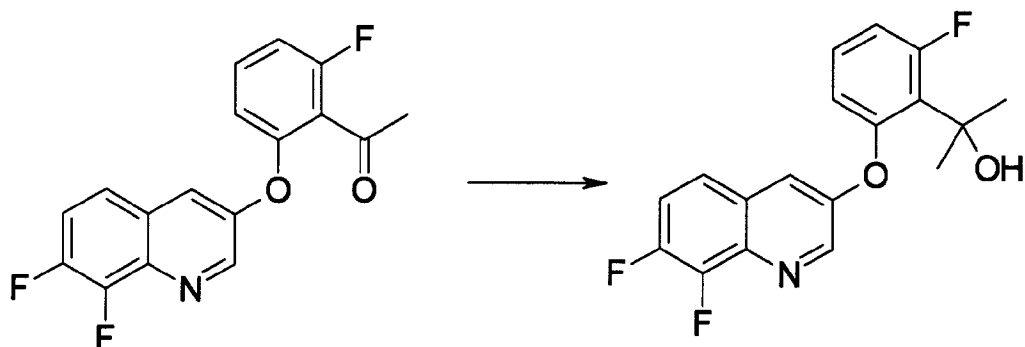
[0185]

実施例 19

g (化合物番号293)を得た。

ン-3-イルオキシ)-フエニル]ー2-メチル-プロパシ-2-オール)0.10
ことで1, 1-ジフルオロ-1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリ
た。有機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製する
下した。0°Cで2時間攪拌した後に、希塩酸を加えて、酢酸エチルで分液し
メチルアセタテシウムクロリド (3.0 Mテトラヒドロフラン溶液) 0.4mlを滴
シ)ー酢酸エチル0.18 gをテトラヒドロフラン3mlに溶解させて、0°Cにて

[化31]

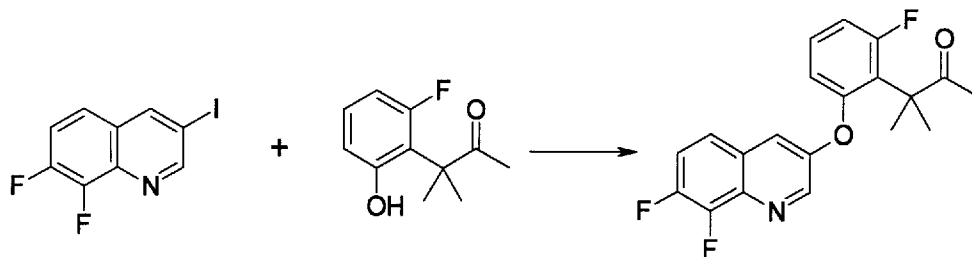


[0190] 1-[2-(7,8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)-6-フルオロフェニル]-エタノン0.64 gをテトラヒドロフラン10mlに溶解した後に、0℃に冷却してメチルマグネシウムクロリド(3.0Mテトラヒドロフラン溶液)1.5mlを滴下した。反応液に希塩酸を加えて、酢酸エチルで分液した。有機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、2-[2-(7,8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)-6-フルオロフェニル]-プロパン-2-オール(化合物番号124)0.49 gを得た。

[0191] 実施例21

3-[2-(7,8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)-6-フルオロフェニル]-3-メチルブタン-2-オンの合成

[0192] [化32]



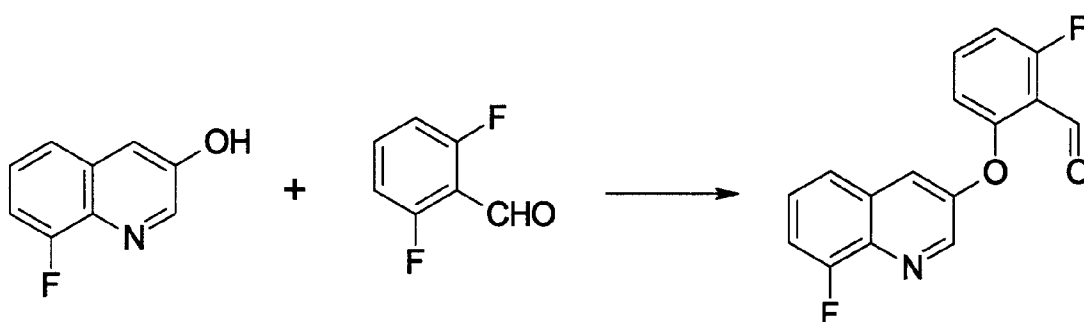
[0193] 7,8-ジフルオロ-3-ヨードキノリン0.78 g、3-(2-フルオロ-6-ヒドロキシフェニル)-3-メチルブタン-2-オン0.26 g、炭酸セシウム1.05 g、ジピバロイルメタン53mg、および塩化銅(I)0.27 gにN-メチルピロリドン3mlを加えた。130℃で48時間攪拌した後に、反応液をセライトでろ過して、酢酸エチルで分液した。有機層を濃縮した後にシリカゲルカ

ラムクロマトグラフィーで精製することで、3-[2-(7,8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)-6-フルオロフェニル]-3-メチルブタン-2-オン（化合物番号267）0.05 gを得た。

[0194] 実施例 2 2

2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-ベンズアルデヒドの合成

[0195] [化33]



[0196] 8-フルオロ-3-ヒドロキシキノリン3.0 gにアセトニトリル30mlを加えた後に、炭酸カリウム3.1 gと2,6-ジフルオロアセトフェノン3.5 gを加えた。反応液を3時間加熱還流した後に、セライトでろ過した。ろ液を酢酸エチルで抽出した後に、有機層を濃縮して、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-ベンズアルデヒド（化合物番号341）3.0 gを得た。

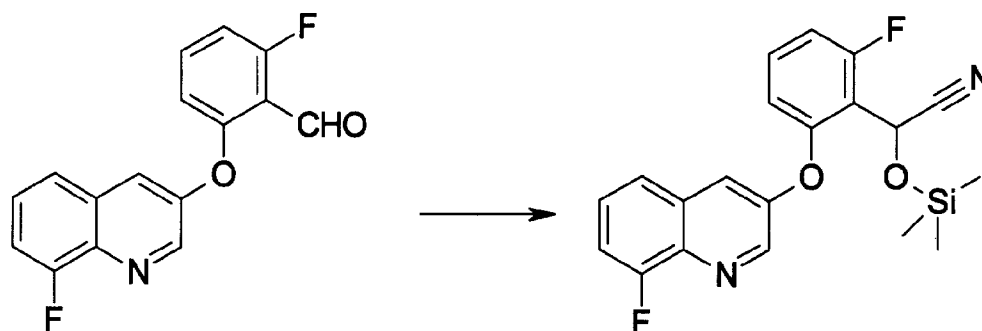
[0197] 実施例 2 3

1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-プロパン-1,2-ジオンの合成

[0198] 工程 1) [2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-トリメチルシリルオキシ-アセトニトリルの合成

[0199]

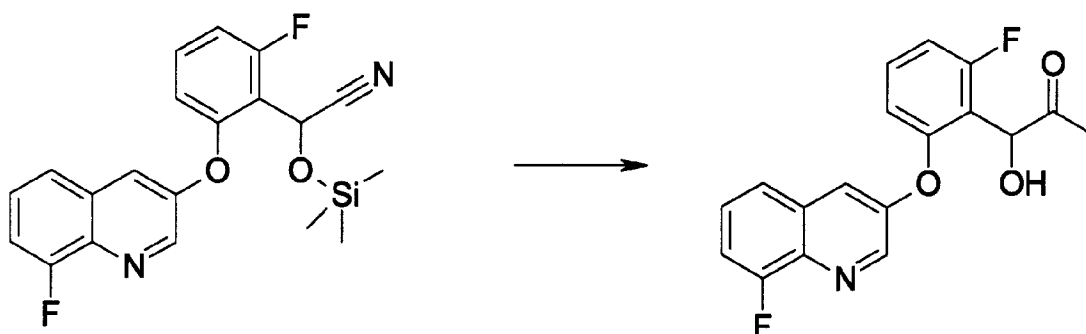
[化34]



[0200] 2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-ベンズアルデヒド3.2 gをジクロロメタン70mlに溶解させて、0℃に冷却してからテトライソプロポキシチタン1.3 gを加えた。反応液を室温まで昇温した後にトリメチルシリルシアニド4.5 gを加えて2時間攪拌した。反応液に希塩酸を加えて、ジクロロメタンで抽出した。有機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-トリメチルシリルオキシアセトニトリル3.1 g (純度約90%)を得た。

[0201] 工程2) 1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-1-ヒドロキシープロパン-2-オンの合成

[0202] [化35]



[0203] [2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-トリメチルシリルオキシアセトニトリル3.3 g (純度約90%)をジエチルエーテル50mlに溶解させて、室温下メチルマグネシウムブロミド (3.0 Mジエチルエーテル溶液) 5.7mlを滴下した。室温にて1時間攪拌した後に、

3時間加熱還流してから、希塩酸で処理した。酢酸エチルで抽出して、有機

層を濃縮すること、3.9gの粗生成物を得た。この粗生成物1.9gに2N塩酸2

0mlとテトラヒドロフラン10mlを加え室温で4時間攪拌した。反応液を酢酸エ

チルで抽出した後に、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製すること

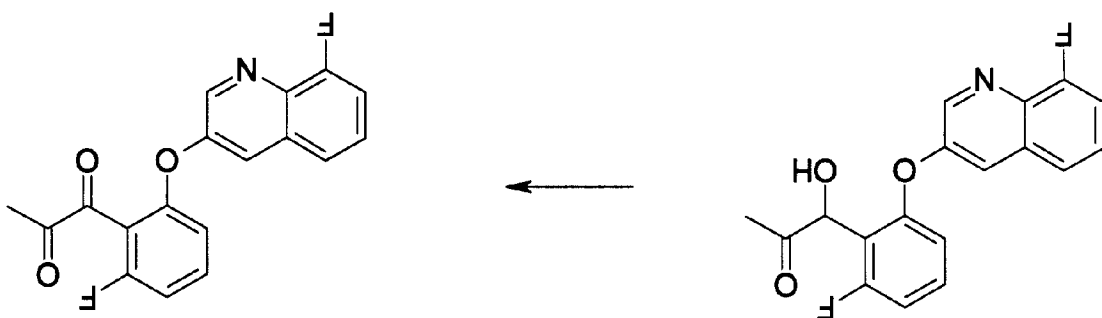
で1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-1-

エニル]-1-ヒドロキシ-プロパン-2-オール0.4gを得た。

[0204] 工程3) 1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ

シ)-1-エニル]-プロパン-1, 2-ジオールの合成

[0205] [化36]



[0206] 1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-1-

エニル]-1-ヒドロキシ-プロパン-2-オール0.14gをジクロロメタン10ml

に溶解させて、0℃にてデス・マーチン試薬0.19gを加えた。3時間攪拌後

、反応液を濃縮して、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製すること

で1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-1-

エニル]-プロパン-1, 2-ジオール (化合物番号396) 0.08gを得た。

[0207] 実施例24

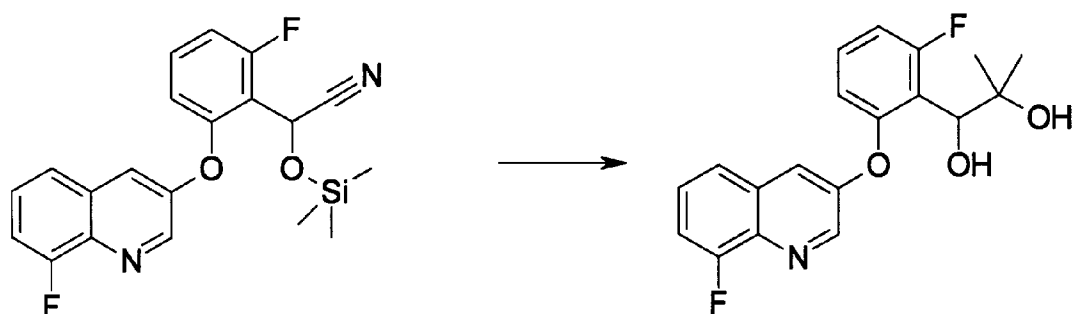
エニル]-2-ヒドロキシ-2-メチル-プロパン-1-オールの合成

[0208] 工程1) 1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ

シ)-1-エニル]-2-メチル-プロパン-1, 2-ジオールの合成

[0209]

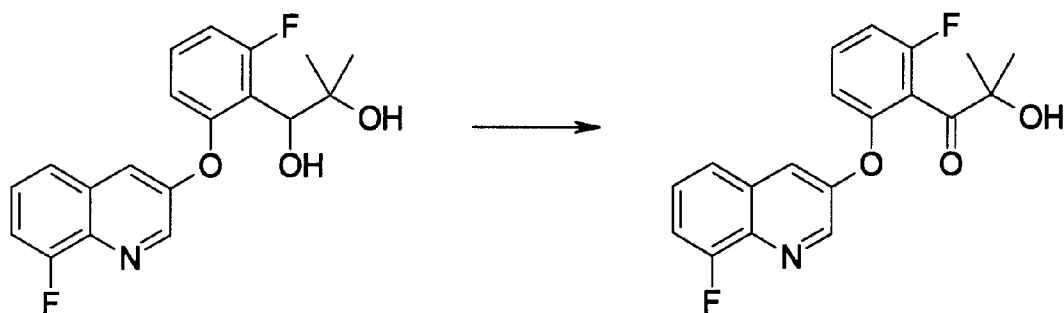
[化37]



[0210] [2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-トリメチルシリルオキシーアセトニトリル3.3 gをジエチルエーテル50mlに溶解させて、室温下メチルマグネシウムブロミド (3.0Mジエチルエーテル溶液) 5.7mlを滴下した。室温にて1時間攪拌した後に、3時間加熱還流してから、希塩酸で処理した。酢酸エチルで抽出して、有機層を濃縮することで3.9 gの粗生成物を得た。この粗生成物1.9 gをテトラヒドロフラン20mlに溶解させて、0℃にてメチルマグネシウムブロミド (3.0Mジエチルエーテル溶液) 3.2mlを滴下した。0℃で3時間攪拌後、2 N塩酸を20ml加えて室温で1昼夜攪拌した。反応液を酢酸エチルで抽出した後に、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-2-メチルプロパン-1, 2-ジオール0.25 gを粗生成物として得た。

[0211] 工程2) 1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-2-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-1-オンの合成

[0212] [化38]

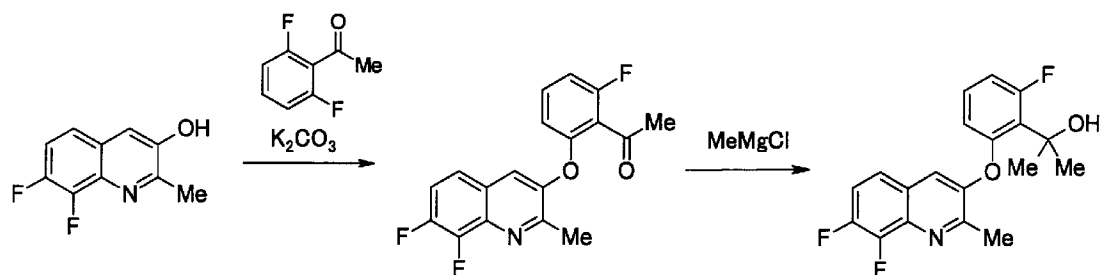


[0213] 1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-2-メチルプロパン-1, 2-ジオール0.15 gをジクロロメタン10mlに溶解させて、0℃にてデス・マーチン試薬0.20 gを加えた。2時間攪拌後、反応液を濃縮して、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで1-[2-フルオロ-6-(8-フルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-2-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-1-オン（化合物番号398）0.03 gを得た。

[0214] 実施例 25

2-[2-フルオロ-6-(7, 8-ジフルオロ-2-メチルキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]プロパン-2-オールの合成

[0215] [化39]



[0216] 7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリン26.3 gをジメチルホルムアミド 200mLに溶解し、この溶液に2, 6-ジフルオロアセトフェノン27.2 g、炭酸カリウム24.0 gを加え、100℃で4時間攪拌した。得られた反応液を氷水に注ぎ、希塩酸で中和した後、酢酸エチルで分液した。有機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、1-[2-フルオロ-6-(7, 8-ジフルオロ-2-メチルキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-エタノン17.0 gを得た。

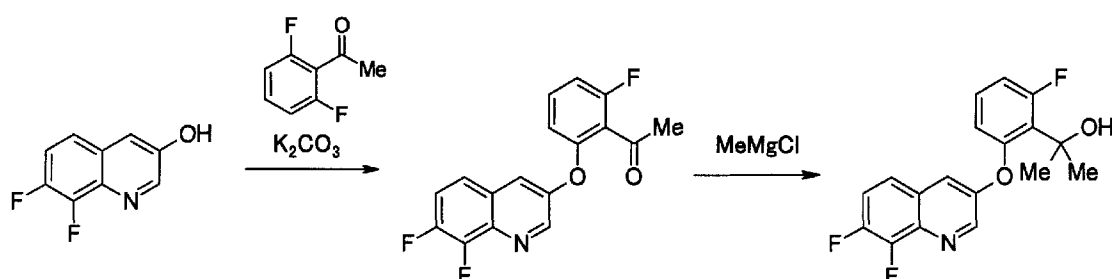
得られた1-[2-フルオロ-6-(7, 8-ジフルオロ-2-メチルキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-エタノン11.0 gをテトラヒドロフラン80mlに溶解して、0℃に冷却した後にメチルマグネシウムクロリド（3.0 Mテトラヒドロフラン溶液）16.6mlを滴下した。室温まで反応温度を上げ、2時間攪拌した後、反応液を希塩酸で処理して、酢酸エチルで分液した。有

機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、2-[2-フルオロ-6-(7,8-ジフルオロ-2-メチルキノリン-3-イルオキシ)フェニル]プロパン-2-オール(化合物番号125) 10.0 gを得た。

[0217] 実施例 26

2-[2-フルオロ-6-(7,8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)フェニル]プロパン-2-オールの合成

[0218] [化40]



[0219] 7,8-ジフルオロ-3-ヒドロキシキノリン0.5 gをジメチルホルムアミド 10mLに溶解し、この溶液に2,6-ジフルオロアセトフェノン0.52 g、炭酸カリウム0.46 gを加え、100℃で2.5時間攪拌した。得られた反応液を氷水に注ぎ、希塩酸で中和した後、酢酸エチルで分液した。有機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、1-[2-フルオロ-6-(7,8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-エタノン(化合物番号391) 0.38 gを得た。

得られた1-[2-フルオロ-6-(7,8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)-フェニル]-エタノン0.38 gをテトラヒドロフラン5mlに溶解して、0℃に冷却した後にメチルマグネシウムブロマイド(3.0Mジエチルエーテル溶液) 1.4mlを滴下した。室温まで反応温度を上げ、2時間攪拌した後、反応液を希塩酸で処理して、酢酸エチルで分液した。有機層を濃縮した後にシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することで、2-[2-フルオロ-6-(7,8-ジフルオロキノリン-3-イルオキシ)フェニル]プロパン-2-オール(化合物番号124) 0.33 gを得た。

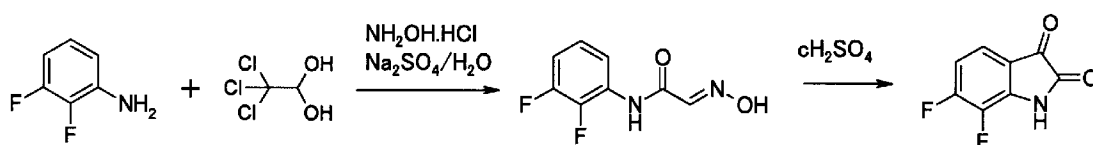
[0220] 次に、実施例を挙げて本発明の製造中間体について更に詳細に説明するが、本発明の製造中間体は以下の実施例により何ら限定されることはない。

[0221] 実施例 27

7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリンの合成

[0222] 工程 1) 6, 7-ジフルオロイサチンの合成

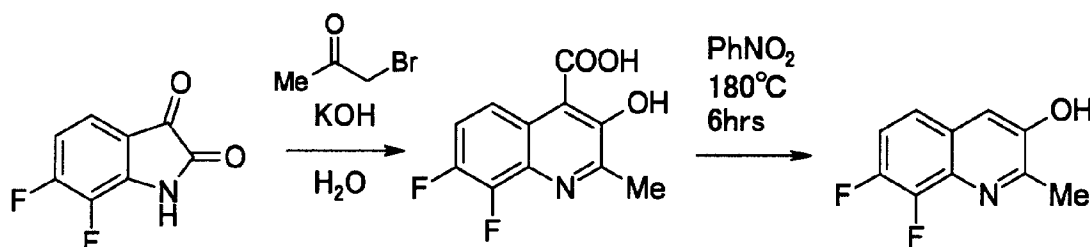
[0223] [化41]



[0224] 2, 3-ジフルオロアニリン15.7 gを825mLの水に加え、続いてトリクロロアセトアルデヒド1水和物24.2 g、ヒドロキシアミン塩酸塩30.8 g、無水硫酸ナトリウム138.6 gを加え、10時間、50℃で攪拌した。室温まで冷却後、2 N塩酸を44mL加え30分攪拌後、結晶を濾取した。得られた結晶を乾燥後、70℃に加熱した濃硫酸に加え、80～90℃にて1時間攪拌した。反応液を氷に注ぎ、酢酸エチルで抽出を行い、飽和食塩水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧下で留去し、6, 7-ジフルオロイサチンの粗生成物を26 g得た。

[0225] 工程 2) 7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリンの合成

[0226] [化42]



[0227] 6, 7-ジフルオロイサチンの粗生成物41 gを水200mLに加え、氷冷下水酸化カリウム75.3 g (6当量)を加え30分攪拌した。この懸濁液にブromoアセトフェノン42 g (1.4当量)を反応液の内温を20～25℃に保ちながら滴下し、さらに一晩室温にて攪拌を行った。濃塩酸で中和後、析出した結晶を濾取し、

少量の水で洗浄を行った。得られた結晶を十分乾燥後、130～140℃に加熱したニトロベンゼン100mLに少しずつ加え、さらに150℃で1時間攪拌した。反応液を室温まで冷却した後、析出した結晶をクロロホルムで洗浄し、7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリン26.3 gを得た。

^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 2.57 (s, 3H), 7.4-7.7 (m, 3H), 10.60 (bs, 1H).

[0228] 同様の方法により以下の化合物を製造した。

8-フルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリン

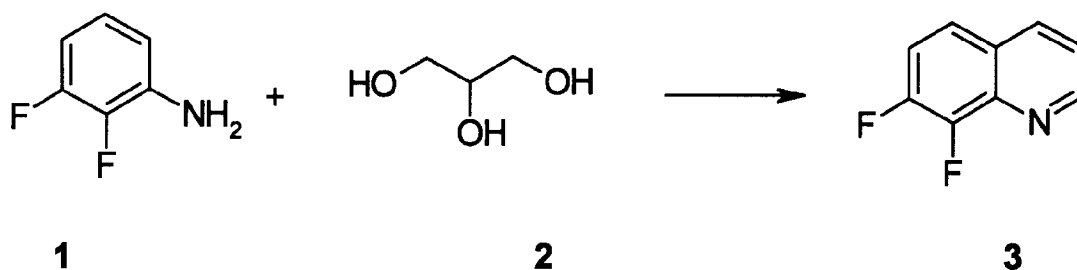
^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 2.56 (s, 3H), 7.2-7.6 (m, 4H), 10.53 (bs, 1H).

[0229] 実施例 28

7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシキノリンの合成

[0230] 工程 1) 7, 8-ジフルオロキノリンの合成

[0231] [化43]

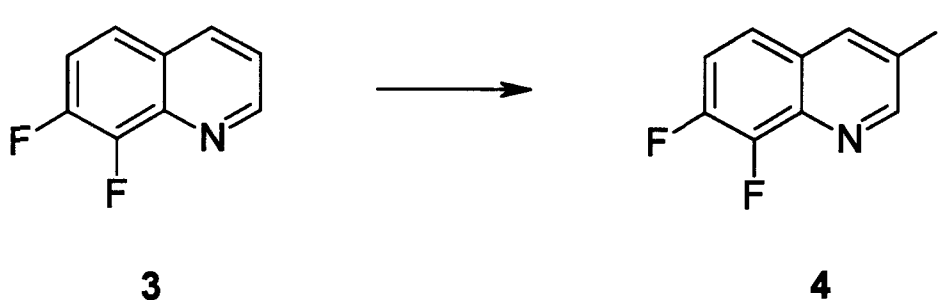


[0232] 攪拌子の入った3 Lのナス型フラスコに80% 硫酸 (607.7 g, 49.57 mol) を入れ、0℃に冷却後、2, 3-ジフルオロアニリン (160.0 g, 1.24 mol) を徐々に加えた。添加後、室温で1時間攪拌し、さらにヨウ化ナトリウム (1.85 g, 12.3 mmol) を加え、オイルバスで150℃ (バスの温度) になるまで加熱した。この温度になったところで、グリセリン (125.5 g, 1.36 mol) を1時間かけて滴下し、150℃で1時間攪拌した。さらにバスの温度を180℃まで昇温し、蒸留装置を用いて水を2時間かけて留去した。原料の消失を確認した後、氷水のバスで冷却しながら10Nの水酸化ナトリウム水溶液を用いて中和した (内温は60-70℃)。中和後、内温が室温に戻る前に酢酸エチルで抽出し、

硫酸マグネシウムで乾燥、濾過、濃縮を行った。得られた粗精製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し（ノルマルヘキサン：酢酸エチル）、7, 8-ジフルオロキノリンを185.5 g (91%) 薄茶色の固体として得た。

[0233] 工程2) 7, 8-ジフルオロ-3-ヨードキノリンの合成

[化44]



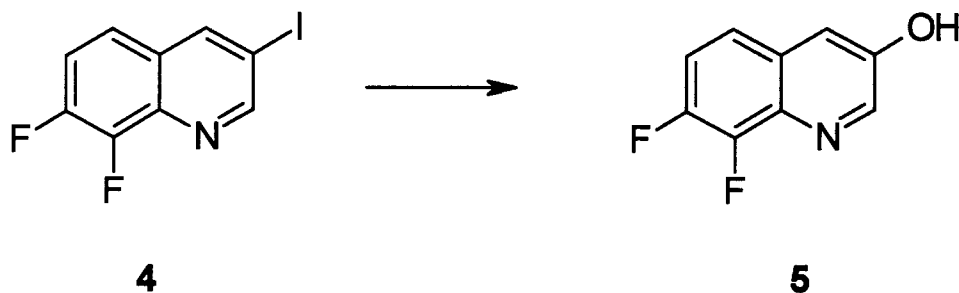
[0234] 攪拌子の入った3 Lのナス型フラスコに7, 8-ジフルオロキノリン(185.5 g, 1.12 mol)、N-ヨードスクシンイミド (505.4 g, 2.25 mol)、酢酸 (927 mL) を入れ、90℃で30 時間攪拌した。冷却後、析出した結晶を濾過し、乾燥した。一方、濾液は減圧下で濃縮し、残存した酢酸を炭酸水素ナトリウムで中和した後、酢酸エチルで抽出した。さらに、硫酸マグネシウムで乾燥、濾過、濃縮を行った後、得られた粗精製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し（ノルマルヘキサン：酢酸エチル）、先に得られた結晶と合わせて7, 8-ジフルオロ-3-ヨードキノリンを227.2 g (70%) 薄茶色の固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 7.39–7.51 (m, 2 H), 8.55 (m, 1H), 9.08 (d, 1 H, $J = 2.1\text{Hz}$).

[0235] 工程3) 7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシキノリンの合成

[0236]

[化45]



[0237] 攪拌子の入った3 Lのナス型フラスコに7, 8-ジフルオロ-3-ヨードキノリン (227.2 g, 0.78 mol)、ジメチルスルホキシド (600 mL)、水 (600 mL) を入れ、水酸化カリウム (131.5 g, 2.34 mol)、CuI (14.8 g, 0.078 mol)、1, 10-フェナントリン (28.1 g, 0.156 mol)、を加えた。さらにオイルバスで100℃に加熱し、24時間攪拌した。冷却した後、酢酸エチルと水を加え、有機層を除いた。得られた水層を濃塩酸によって中和し、析出した結晶を濾過、乾燥した。一方、濾液は酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥、濾過、濃縮を行った後、得られた粗精製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し ((ノルマルヘキサン: 酢酸エチル)、先に得られた結晶と合わせて7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシキノリンを133.7 g (95%) 薄茶色の固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CD_3OD) δ 7.39–7.60 (m, 3H), 8.59 (d, 1H, $J = 2.4\text{Hz}$).

[0238] 同様の方法により以下の化合物を製造した。

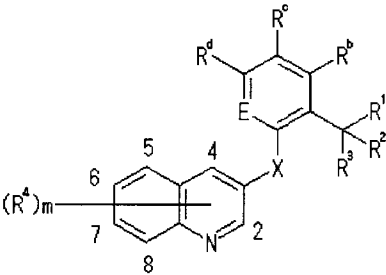
8-フルオロ-3-ヒドロキシキノリン

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 7.16 (m, 1 H), 7.34–7.49 (m, 3H), 8.71 (d, 1 H, $J = 2.7\text{Hz}$), 9.90 (bs, 1H).

[0239] 上記の実施例で得られた含窒素ヘテロ環化合物を表1～19に示す。なお、上記の実施例のいずれかと同様の手法によって、合成した化合物をさらに、表20～表28に示す。また、Etはエチル基、 ^nPr はn-プロピル基、 ^iPr は、i-プロピル基、 ^oPr はシクロプロピル基、 ^nBu は、n-ブチル基、 ^tBu はt-ブチル基、Phはフェニル基、Bnはベンジル基、Tosはトルエンスルホニル基をそれぞれ示す。また、各表に示した化合物の $^1\text{H-NMR}$ を

表 2 9 ～ 表 4 1 に示す。

[0240] [表1]



化合物番号	(R ^A) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
1	-	=O		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	75-76
2	-	=O		-H	H	H	H	CH	-O-	76-79
3	-	=O		-OEt	H	H	H	CH	-O-	amorphous
4	-	=O		-OEt	H	H	H	CF	-O-	72-74
5	-	=O		-OEt	H	H	F	CH	-O-	amorphous
6	-	=O		-OEt	H	F	H	CH	-O-	93-95
7	-	=O		-OEt	F	H	H	CH	-O-	amorphous
8	8-F	=O		-OEt	F	H	H	CH	-O-	amorphous
9	-	-F	-F	-F	H	H	H	CH	-O-	amorphous
10	8-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
11	-	=O		- ^t Bu	H	H	H	CH	-O-	amorphous
12	8-F	=O		- ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	amorphous
13	-	-F	-F	-F	H	H	H	N	-O-	amorphous
14	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
15	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	77-79
16	-	-CH ₃	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	90-94

[0241]

[表2]

化合物番号	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
17	-	-CH ₃	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	amorphous
18	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	amorphous
19	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	104-106
20	-	=O		-NH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	168-188
21	-	=O		-NH ₂	Br	H	H	CH	-O-	204-206
22	-	=O		-N(CH ₃) ₂	Br	H	H	CH	-O-	amorphous
23	-	=N-OH		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	125-126
24	-	=N-OCH ₃		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
25	-	=N-O ^t Bu		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
26	8-F	=N-OH		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	171-173
27	-	-OCH ₃	-CH ₃	-OCH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
28	-	-OSi(CH ₃) ₃	-CH ₃	-CF ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
29	-	-OH	-CH ₃	-CF ₃	H	H	H	CH	-O-	158-160
30	8-F	-OH	-CH ₃	- ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	amorphous
31	-	-OH	-CH ₃	- ^t Bu	H	H	H	CH	-O-	amorphous
32	-	-OH	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	129-131
33	8-F	-OH	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	122-124
34	8-F	-OH	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	amorphous
35	8-F	-OH	- ^t Bu	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	amorphous
36	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
37	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
38	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
39	2- ^t Bu	=O		-H	H	H	H	CH	-O-	amorphous
40	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CF	-O-	amorphous
41	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	F	CH	-O-	amorphous
42	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	F	H	CH	-O-	amorphous

[0242] [表3]

化合物番号	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
43	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
44	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	126-130
45	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	N	-O-	146-147
46	2-Et	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
47	2- ⁿ Bu	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
48	8-F	-OH	-CH ₃	-Et	F	H	H	CH	-O-	amorphous
49	8-Cl	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
50	-	=O		-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-NH-	130-132
51	-	=O		-Ph	H	H	H	CH	-NH-	amorphous
52	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH ₂ -	108-111
53	8-F	=O		-OEt	F	H	H	CH	-CH ₂ -	amorphous
54	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH(OH)-	173-175
55	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -OSi(CH ₃) ₂ - ^t Bu	H	H	H	CH	-CH(OH)-	140-143
56	-	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	CH	-CH(OH)-	136-138
57	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CO-	182-183
58	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -OSi(CH ₃) ₂ - ^t Bu	H	H	H	CH	-CO-	105-108
59	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ O-Tos	H	H	H	CH	-CO-	amorphous
60	2-Cl	-CH ₃	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	amorphous
61	1-Oxide, 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	amorphous
62	-		≡N		H	H	H	CH	-O-	92-95
63	-		≡N		F	H	H	CH	-O-	149-151
64	-		≡N		Br	H	H	CH	-O-	167-169
65	-		≡N		Cl	H	H	CH	-O-	150-151
66	-		≡N		OMe	H	H	CH	-O-	120-122

[0243]

[表4]

化合物番号	(R ³) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
67	2-CH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
68	2- ⁱ Pr	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
69	2-OCH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
70	2-OEt	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
71	1-Oxide	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	154-155
72	-	-OH	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
73	-	-OH	-CH ₃	-CO ₂ Et	H	H	H	CH	-O-	amorphous
74	8-F	-OH	-CH ₃	-Ph	F	H	H	CH	-O-	amorphous
75	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ Ph	F	H	H	CH	-O-	amorphous
76	8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	amorphous
77	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	amorphous
78	2-CH=CH ₂ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	amorphous
79	2-CH ₂ CH=CH ₂ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	amorphous
80	8-F	-OH	-CH ₃	- ⁱ Pr	F	H	H	CH	-O-	amorphous
81	8-F	-OH	-CH ₃	-C(CH ₃)=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	amorphous
82	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -(4-FPh)	F	H	H	CH	-O-	amorphous
83	8-F	-OH	-CH ₃	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	amorphous
84	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CF	-O-	149-150
85	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CF	-O-	111-113
86	8-F	-OH	-CH ₃	- ^o Pr	F	H	H	CH	-O-	amorphous
87	2- ^o Pr, 8-F	-OH	-CH ₃	- ^o Pr	F	H	H	CH	-O-	amorphous
88	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-Et	F	H	H	CH	-O-	amorphous
89	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	F	H	H	CH	-O-	amorphous
90	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	- ^o Pr	F	H	H	CH	-O-	amorphous
91	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -(4-CH ₃ OPh)	F	H	H	CH	-O-	amorphous
92	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ -(4-FPh)	F	H	H	CH	-O-	amorphous

[0244] [表5]

化合物番号	(R ³) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
93	2-CH ₃ , 8-Cl	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	96-98
94	2,8-(CH ₃) ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
95	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	120-123
96	8-F	-OH	-CH ₃	-Et	Cl	H	H	CH	-O-	38-42
97	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
98	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	107-110
99	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	Cl	H	CH	-O-	124-126
100	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	93-94
101	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	CH ₃	H	CH	-O-	amorphous
102	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	135-137
103	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
104	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	F	H	CH	-O-	122-124
105	2-CH ₃ , 6-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
106	2-CH ₃ , 7-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	98-100
107	2-CH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
108	2-CH ₃	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
109	-	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	93-94
110	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	136-140
111	-	-OH	-CH ₃	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
112	-	-OH	-CF ₃	-CF ₃	H	H	H	CH	-O-	170-172
113	-	-OSi(CH ₃) ₃	-CF ₃	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
114	-	-OH	-CF ₃	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	130-132
115	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	115-116
116	5,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	154-155
117	2-CH ₃ , 5,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	124-126
118	2-CH ₃ , 7-Cl	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous

[0245]

[表6]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
119	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	F	H	CH	-O-	amorphous
120	5-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	90-92
121	2-CH ₃ , 5-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	95-97
122	8-F	-OH	-CF ₃	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	151-153
123	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	CH ₃	H	CH	-O-	118-120
124	7,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	78-80
125	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	108-110
126	7-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
127	2-CH ₃ , 4,8-F ₂	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	130-132
128	2-CH ₃ , 7-F	-OH	-CH ₃	-Et	F	H	H	CH	-O-	mp 1.5580
129	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-CH ₃	-CN	F	H	H	CH	-O-	
130	8-F	-OH	-CH ₃	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	
131	-	-OCH ₃	-H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	amorphous
132	-	-OCH ₃	-H	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
133	-	-OEt	-H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	amorphous
134	-	-O ⁱ Pr	-H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	amorphous
135	-	-O ^t Bu	-H	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
136	-	-OH	-H	- ⁱ Bu	H	H	H	CH	-O-	amorphous
137	-	-OH	-H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH	-O-	amorphous
138	8-F	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	148-151
139	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	- ⁱ Bu	F	H	H	CH	-O-	104-106
140	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
141	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	139-141
142	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	amorphous
143	8-F	-OH	-H	- ⁿ Pr	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
144	8-F	-OH	-H	-O(CH ₂)=CH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	100-104

[0246] [表7]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
145	8-F	-OH	-H	- ⁱ Bu	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
146	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
147	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
148	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	amorphous
149	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	amorphous
150	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CH ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
151	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	112-114
152	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
153	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CN	H	H	CH	-O-	amorphous
154	8-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	amorphous
155	8-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CH ₃	OCH ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
156	8-F	-OCH ₂ CH=CH ₂	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
157	8-F	-OH	-H	-Et	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
158	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-H	-CF ₃	Cl	H	H	CH	-O-	115-117
159	8-F	-OH	-H	-CF ₃	Cl	H	H	CH	-O-	174-176
160	8-F	-OCH ₂ Ph	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
161	8-F	-OH	-H	-Ph	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
162	8-F	-OH	-H	-CH=CH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	98-100
163	8-F	-OH	-H	- ⁿ Bu	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
164	8-F	-OH	-H	-C≡CH	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
165	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-H	-CN	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
166	8-F	-OH	-H	-CH ₃	NO ₂	H	H	CH	-O-	112-114
167	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	NO ₂	H	H	CH	-O-	amorphous
168	8-F	-OCH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
169	8-F	-OH	-H	-CN	Cl	H	H	CH	-O-	174-175
170	8-F	-OSi(CH ₃) ₃	-H	-COOCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous

[0247]

[表8]

化合物番号	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
171	8-F	-OH	-H	-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
172	8-F	-OCH ₃	-H	-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
173	8-F	-OH	-H	-C(CH ₃) ₂ OH	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
174	8-F	-OH	-H	-CH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
175	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
176	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	148-150
177	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	amorphous
178	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	130-131
179	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	119-121
180	8-F	-OCH ₃	-H	-C(CH ₃) ₂ OH	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
181	8-F	-OH	-H	-CO ₂ CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
182	8-F	-OH	-H	-CH ₂ CN	Cl	H	H	CH	-O-	123-125
183	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	124-126
184	2-CH ₃ , 8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	108-110
185	8-F	-OH	-H	-CH ₃	CF ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
186	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CF ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
187	-	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	77-80
188	-	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
189	-	-OH	-H	-CH ₃	H	H	H	CF	-O-	amorphous
190	-	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CF	-O-	amorphous
191	-	-OH	-H	-CF ₃	H	H	H	CH	-O-	157-159
192	-	-OH	-H	-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	132-135
193	-	-OH	-H	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	129-131
194	5,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	115-116
195	5-F	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	114-115
196	8-F	-OH	-H	-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	100-101

[0248] [表9]

化合物番号	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
197	7,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	99-102
198	7,8-F ₂	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
199	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	135-136
200	2-CH ₃ , 7,8-F ₂	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	127-129
201	7-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	92-94
202	2-CH ₃ , 7-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	98-100
203	7-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
204	8-F	-OH	-H	-C(=N-OCH ₃)-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
205	8-F	-OH	-H	-CH ₃	I	H	H	CH	-O-	116-118
206	2-CH ₃ , 4,8-F ₂	-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
207	8-F	-N(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ ₃ , 5836
208	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	I	H	H	CH	-O-	61-63
209	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
210	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	COCH ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
211	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	SCH ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
212	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
213	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	OCH ₃	H	H	CH	-O-	
214	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	ⁱ Pr	H	H	CH	-O-	
215	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	Ph	H	H	CH	-O-	amorphous
216	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	N(CH ₃) ₂	H	H	CH	-O-	
217	8-F	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
218	8-F	-OEt	-H	-OEt	F	H	H	CH	-O-	amorphous
219	8-F	-OH	-H	-H	Cl	H	H	CH	-O-	141-143
220	8-F	-OCH ₃	-H	-H	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
221	8-F	-OCH ₂ CH=CH ₂	-H	-H	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
222	8-F	-OH	-H	-H	Br	H	H	CH	-O-	142-144

[0249]

[表10]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
223	8-F	-OCH ₃	-H	-H	Br	H	H	CH	-O-	amorphous
224	8-F	-NH ⁿ Bu	-H	-H	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
225	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
226	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ O-Tos	H	H	H	CH	-O-	amorphous
227	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
228	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	106-108
229	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CHO	H	H	H	CH	-O-	121-123
230	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
231	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH=N-OH	H	H	H	CH	-O-	158-159
232	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CN	H	H	H	CH	-O-	amorphous
233	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -COOCH ₃	H	H	H	CH	-O-	107-109
234	-	-CH ₃	-CH ₃	-CHO	H	H	H	CH	-O-	amorphous
235	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	amorphous
236	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	130-131
237	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	136-138
238	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CHO	H	H	H	CH	-O-	148-149
239	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CHO	F	H	H	CH	-O-	156-158
240	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	147-148
241	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
242	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	120-122
243	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ -O(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
244	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
245	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CHO	H	H	H	CH	-O-	93-96
246	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
247	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH(COOCH ₃) ₂	H	H	H	CH	-O-	amorphous
248	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH(COOCH ₃) ₂	H	H	H	CH	-O-	amorphous

[0250] [表11]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
249	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CO ₂ H	H	H	H	CH	-O-	181-184
250	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CO ₂ CH ₃	H	H	H	CH	-O-	123-125
251	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
252	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
253	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
254	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH(OH)Et	H	H	H	CH	-O-	amorphous
255	-	-CH ₃	-CH ₃	-CH(OH)-O(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
256	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
257	2-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -COOCH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
258	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
259	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	amorphous
260	-	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
261	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ COOCH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
262	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
263	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	amorphous
264	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	139-141
265	-	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
266	7-F	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
267	7,8-F ₂	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
268	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CH(CH ₃)OH	H	H	H	CH	-O-	viscous oil
269	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-COOCH ₃	H	H	H	CH	-O-	viscous oil
270	2-CH ₃ , 8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	H	CH	-O-	viscous oil
271	-	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	H	CH	-O-	amorphous
272	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	H	CH	-O-	126-128
273	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CONH ₂	H	H	H	CH	-O-	172-175
274	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CON(CH ₃) ₂	H	H	H	CH	-O-	164-166

[0251]

[表12]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
275	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-SO ₂ CH ₃	F	H	H	CH	-O-	175-177
276	-	-H	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	96-98
277	-	-H	-CH ₃	-Et	H	H	H	CH	-O-	amorphous
278	-	-H	-CH ₃	-iPr	H	H	H	CH	-O-	amorphous
279	-	-H	-CH ₃	-tBu	H	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ 1.6215
280	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
281	-	-H	-H	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	131-132
282	-	-H	-H	-H	H	H	H	CH	-O-	46-48
283	-	-H	-H	-H	F	H	H	CH	-O-	74-75
284	8-F	-H	-H	-H	F	H	H	CH	-O-	82-83
285	-	-CH=CH-CH=CH-				H	H	CH	-O-	105-106
286	-	-(CH ₂) ₄ -				H	H	CH	-O-	amorphous
287	-	-(CH ₂) ₃ -				H	H	CH	-O-	68-70
288	-	-CH=CH-CH ₂ CH ₂ -				H	H	CH	-O-	67-69
289	-	-F	-F	-CO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	106-109
290	-	-F	-F	-CH ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	129-131
291	-	-F	-F	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	99-101
292	8-F	-F	-F	-CO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ 1.5400
293	8-F	-F	-F	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	114-116
294	8-F	-F	-F	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	60-63
295	8-F	-F	-F	-CON(CH ₃)OCH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
296	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	104-106
297	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	F	H	H	CH	-O-	amorphous
298	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OH	F	H	H	CH	-O-	128-130
299	-	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	F	H	H	CH	-O-	91-93
300	-	-(CH ₂) ₂ -		-OH	F	H	H	CH	-O-	123-124

[0252] [表13]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
301	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OH	Cl	H	H	CH	-O-	
302	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OH	Cl	H	H	CH	-O-	
303	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	
304	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-OCH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	
305	-	=CH ₂		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	72-74
306	2-Cl	=CH ₂		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	amorphous
307	2-OH	=CH ₂		-CH ₃	H	H	H	CH	-O-	135-139
308	8-F	-O-CH ₂ -		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
309	-	-(CH ₂) ₄ -		-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	86-88
310	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-CN	F	H	H	CH	-O-	142-144
311	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-CN	F	H	H	CH	-O-	132-134
312	8-F	-(CH ₂) ₂ -		-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	
313	2-CH ₃ , 8-F	-(CH ₂) ₂ -		-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	
314	2-CH ₃ , 8-F	=N-OH		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	168-170
315	8-F	=N-OH		-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	155-158
316	8-F	=N-OH		-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	145-147
317	8-F	=N-OH		-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	199-202
318	2-CH ₃ , 7-F	=N-OCH ₃		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ 1.5712
319	2-CH ₃ , 7-F	=N-OEt		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ 1.5629
320	-	=N-OtBu		-H	F	H	H	CH	-O-	105-107
321	8-F	≡N			F	H	H	CH	-O-	184-185
322	-	Ph			H	H	H	CH	-O-	85-86
323	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-CH ₂ -	146-149
324	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH ₂ -	114-116
325	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	H	CH	-CH ₂ -	158-161
326	-	-CH ₃	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CH ₂ OH	H	H	H	CH	-CH ₂ -	115-117

[0253]

[表14]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性	
327	8-F	-OH	-H	-CH ₃	Cl	H	H	CH	-CH ₂ -	151-153	
328	8-F	-OCH ₃	-H	-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-CH ₂ -	amorphous	
329	8-F	=O		-OEt	H	H	H	CH	-CH ₂ -	amorphous	
330	-	=O		-OEt	F	H	H	CH	-CH ₂ -	amorphous	
331	7-F	=O		-OEt	F	H	H	CH	-CH ₂ -	viscous oil	
332	8-F	=O		-H	Cl	H	H	CH	-CH ₂ -	111-112	
333	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-CO-	192-193	
334	-	-OH	-H	-CH=CH ₂	H	H	H	CH	-CO-	amorphous	
335	8-F	=C(CH ₃) ₂		-H	F	H	H	CH	-CO-	43-45	
336	-	-OCH ₂ CH ₂ O-		-H	H	H	H	CH	-CO-	134-136	
337	-	=CH ₂		-H	H	H	H	CH	-CO-	92-95	
338	-	=CH ₂		-CH ₃	H	H	H	CH	-CO-	125-128	
339	-	=C(CH ₃) ₂		-H	H	H	H	CH	-CO-	amorphous	
340	-	-CH=CH-CH=CH-					H	H	CH	-CO-	viscous oil
341	8-F	=O		-H	F	H	H	CH	-CO-	179-181	
342	-	=O		-H	H	H	H	CH	-CO-	120-122	
343	-	=O		-CH=CH ₂	H	H	H	CH	-CO-	amorphous	
344	8-F	-H	-H	-C(CH ₃)=CH ₂	H	H	H	CH	-CO-	amorphous	
345	-	-H	-H	-CH ₂ -N ₃	H	H	H	CH	-CO-	amorphous	
346	-	-H	-H	-Ph	Cl	H	H	CH	-CO-	115-117	
347	-	-H	-H	-C(CH ₃)=CH ₂	F	H	H	CH	-CO-	amorphous	
348	8-F	-H	-H	-C(CH ₃)=CH ₂	F	H	H	CH	-CO-	89-92	
349	8-F	-OCH ₂ CH ₂ O-		-H	F	H	H	CH	-CH(OH)-	159-161	
350	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-CH(OH)-	amorphous	
351	-	=CH ₂		-H	H	H	H	CH	*	amorphous	
352	-	=O		-CO ₂ Et	H	H	H	CH	-O-	amorphous	

[0254] [表15]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
353	8-F	=O		-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
354	8-F	=O		-CH ₃	*2	H	H	CH	-O-	146-148
355	8-F	=O		-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	amorphous
356	8-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	103-104
357	8-F	=O		*3	F	H	H	CH	-O-	amorphous
358	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	96-100
359	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
360	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	Br	H	H	CH	-O-	amorphous
361	8-F	=O		-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	amorphous
362	2,4-(CH ₃) ₂ , 8-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	164-65
363	8-F	=O		- ⁿ Pr	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
364	8-F	=O		-C(CH ₃)=CH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
365	8-F	=O		- ^t Bu	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
366	2-CH ₃ , 8-Cl	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	100-102
367	2,6-(CH ₃) ₂	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
368	8-F	=O		-Ph	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
369	8-F	=O		-CH=CH ₂	Cl	H	H	CH	-O-	77-79
370	8-F	=O		-C≡CH	Cl	H	H	CH	-O-	121-123
371	8-F	=O		- ⁿ Bu	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
372	8-F	=O		-CH ₂ Cl	F	H	H	CH	-O-	113-116
373	8-F	=O		-CHCl ₂	F	H	H	CH	-O-	amorphous
374	8-F	=O		-CCl ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
375	8-F	=O		-COCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
376	8-F	=O		-C(CH ₃) ₂ OH	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
377	8-F	=O		- ⁱ Pr	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
378	8-F	=O		-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	132-135

[0255]

[表16]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
379	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	126-128
380	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	Br	F	H	CH	-O-	126-128
381	-	=O		-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	38-40
382	2-CH ₃ , 6-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
383	2-CH ₃ , 7-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
384	8-F	=O		-CH ₂ O-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
385	-	=O		-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	100-104
386	-	=O		-CH ₃	Cl	F	H	CH	-O-	112-124
387	5,8-F ₂	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	45-48
388	5-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
389	2-CH ₃ , 7-Cl	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
390	8-F	=O		-CF ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
391	7,8-F ₂	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	128-130
392	7,8-F ₂	=O		-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	105-107
393	2-CH ₃ , 8-F	=O		-COOCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	113-114
394	7-F	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	97-99
395	2-CH ₃ , 8-F	=O		-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	169-170
396	8-F	=O		-COOCH ₃	F	H	H	CH	-O-	96-98
397	2-CH ₃ , 8-F	=O		-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	amorphous
398	8-F	=O		-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	amorphous
399	8-F	=O		-C(=N-OCH ₃)-CH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	118-119
400	2-CH ₃ , 4,8-F ₂	=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	155-156
401	-	=O		-NHPh	H	H	H	CH	-O-	amorphous
402	-	=O		-OCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
403	-	=O		-OCH ₃	Br	H	H	CH	-O-	amorphous
404	8-F	=O		-OEt	H	Cl	H	CH	-O-	88-90

[0256] [表17]

化合物番号	(R ^a) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
405	8-F	=O		-OEt	H	CH ₃	H	CH	-O-	88-90
406	8-F	=O		-OCH ₃	Cl	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ _B , 6008
407	8-F	=O		-OPr	Cl	H	H	CH	-O-	n _D ²⁰ _B , 5809
408	8-F	=O		-O-CH ₂ Ph	Cl	H	H	CH	-O-	114-116
409	8-F	=O		-OEt	F	CH ₃	H	CH	-O-	amorphous
410	8-F	=O		-OBu	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
411	8-F	=O		-O-C(CH ₃) ₂ -CO ₂ Et	Cl	H	H	CH	-O-	n _D ²² _B , 1,5411
412	8-F	=O		-H	Cl	F	H	CH	-O-	153-155
413	8-F	=O		-H	Cl	H	H	CH	-O-	133-135
414	8-F	=O		-H	Br	H	H	CH	-O-	111-114
415	8-F	=O		-H	Bn	H	H	CH	-O-	92-94
416	8-F	=O		-H	NO ₂	H	H	CH	-O-	106-109
417	8-F	=O		-H	Br	F	H	CH	-O-	140-142
418	8-F	=O		-H	CF ₃	H	H	CH	-O-	125-127
419	-	=O		-H	Cl	H	H	CH	-O-	82-85
420	-	=O		-H	Cl	F	H	CH	-O-	136-138
421	5,8-F ₂	=O		-H	F	H	H	CH	-O-	118-121
422	5-F	=O		-H	F	H	H	CH	-O-	92-94
423	7,8-F ₂	=O		-H	Cl	H	H	CH	-O-	142-144
424	7-F	=O		-H	Cl	H	H	CH	-O-	122-123
425	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	110-112
426	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-CH(CH ₃)OH	F	H	H	CH	-O-	163-165
427	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-CH(CH ₃)OCH ₃	F	H	H	CH	-O-	amorphous
428	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-C(CH ₃)(Et)OH	F	H	H	CH	-O-	amorphous
429	2-CH ₃ , 8-F	-F	-F	-CH(CH ₃)OCH ₂ CO ₂ H ₃	F	H	H	CH	-O-	141-143
430	8-F	-CH ₂ -		-CO ₂ Et	F	H	H	CH	-O-	amorphous

[0257]

[表18]

化合物番号	$\langle R^A \rangle_m$	R^1	R^2	R^3	R^b	R^c	R^d	E	-X-	物性
431	8-F	$-(CH_2)_2-$		$-C(CH_3)_2OH$	F	H	H	CH	-O-	amorphous
432	8-F	$-CH_3$	$-CH_3$	$-ON$	F	H	H	CH	-O-	110-112
433	8-F	$-NHCO_2^tBu$	$-CH_3$	$-CH_3$	F	H	H	CH	-O-	127-129
434	8-F	$-(CH_2)_2-$		$-NHCO_2^tBu$	F	H	H	CH	-O-	132-134
435	8-F	$-NH_2$	$-CH_3$	$-CH_3$	F	H	H	CH	-O-	amorphous
436	8-F	$-NHCOCH_3$	$-CH_3$	$-CH_3$	F	H	H	CH	-O-	144-146
437	8-F	$-NHCOCF_3$	$-CH_3$	$-CH_3$	F	H	H	CH	-O-	amorphous
438	-	$-OCH_2CH_2O-$		$-H$	H	H	H	CH	$-CH(OH)-$	80-83
439	2- CH_3 , 7,8- F_2	$-OCH_3$	$-CH_3$	$-CH_3$	F	H	H	CH	-O-	97-98
440	2- CH_3 , 8-F	$-OCH_3$	$-CH_3$	$-CH_3$	F	H	H	CH	-O-	94-95
441	2- CH_3 , 7-F	$-OCH_3$	$-CH_3$	$-CH_3$	F	H	H	CH	-O-	104-105
442	8-F	$-N(CH_3)_2$	$-H$	$-ON$	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
443	8-F	$-NHCOCH_3$	$-H$	$-ON$	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous
444	8-F	$-N(Bn)COCH_3$	$-CH_3$	$-CH_3$	F	H	H	CH	-O-	195-197
445	8-F	Pyrolidin-1-yl	$-H$	$-CH_3$	F	H	H	CH	-O-	n_D^{20} 1.5589
446	8-F	$-OCH_3$	$-H$	$-CH_3$	$NHCO_2^tBu$	H	H	CH	-O-	amorphous
447	8-F	$-OCH_3$	$-H$	$-CH_3$	NH_2	H	H	CH	-O-	amorphous
448	8-F	$-OCH_3$	$-H$	$-CH_3$	$NHCH_3$	H	H	CH	-O-	amorphous
449	2- CH_3 , 8-F	$-CH_3$	$-CH_3$	$-SO_2CH_3$	F	H	H	CH	-O-	138-141
450	7,8- F_2	$-CH_3$	$-CH_3$	$-SO_2CH_3$	F	H	H	CH	-O-	157-160
451	2- CH_3 , 7,8- F_2	$-CH_3$	$-CH_3$	$-SO_2CH_3$	F	H	H	CH	-O-	172-175

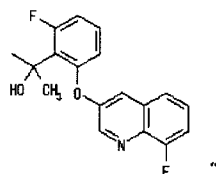
[0258] [表19]

化合物番号	$\langle R^A \rangle_m$	R^1	R^2	R^3	R^b	R^c	R^d	E	-X-	物性
452	8-F	$-CH_3$	$-CH_3$	$-SO_2Et$	F	H	H	CH	-O-	150-152
453	8-F	$-CH_3$	$-H$	$-SO_2CH_3$	Cl	H	H	CH	-O-	amorphous

*1="C(=N-CH₂CH=CH₂)-"

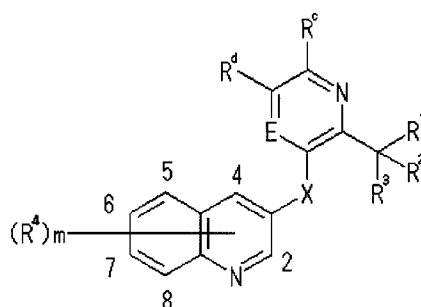
*2="6-Fluoro-quinolin-3-yloxy"

*3="



[0259]

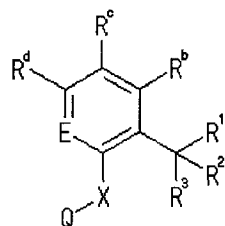
[表20]



化合物番号	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
a-1	-	≡ N			H	H	CH	-O-	149-150
a-2	-	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
a-3	8-F	=O		-H	H	H	CH	-O-	138-140
a-4	2- ^t Bu, 8-F	=O		-H	H	H	CH	-O-	150-151
a-5	8-F	-OH	-CH ₃	- ^t Bu	H	H	CH	-O-	110-112
a-6	8-F	=O		- ^t Bu	H	H	CH	-O-	90-91
a-7	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
a-8	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	H	H	CH	-O-	amorphous
a-9	2-CH ₃ , 8-F	=O		-CH ₃	H	H	CH	-O-	133-134
a-10	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	- ^t Bu	H	H	CH	-O-	133-136
a-11	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CN	H	H	CH	-O-	
a-12	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-CO ₂ Et	H	H	CH	-O-	
a-13	8-F	-F	-F	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	CH	-O-	
a-14	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	CH	-O-	
a-15	8-F	-CH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	H	H	CH	-O-	

[0260]

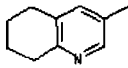
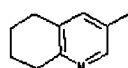
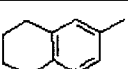
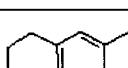
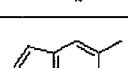
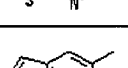
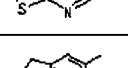
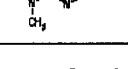
[表21]



化合物番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
b-1		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-2		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	133-135
b-3		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-4		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-5		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-6		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil

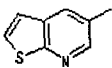
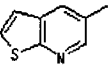
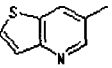
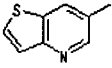
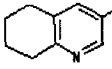
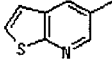
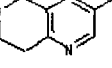
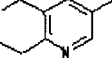
[0261]

[表22]

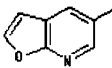
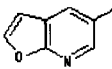
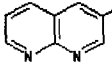
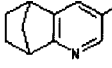
化合物番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
b-7		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-8		-OH	-CH ₃	- ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-9		-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-10		-OCH ₃	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-11		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-12		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-13		-CH ₃	-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OH	H	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-14		-OH	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil

[0262]

[表23]

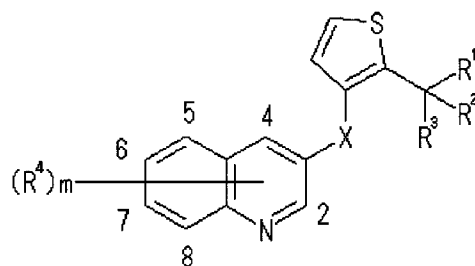
化合物番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
b-15		-OCH ₃	-H	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-16		-OH	-CH ₃	- ^t Bu	F	H	H	CH	-O-	amorphous
b-17		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	78-80
b-18		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	101-102
b-19		=C(CH ₃) ₂		-H	F	H	H	CH	-CO-	viscous oil
b-20		=C(CH ₃) ₂		-H	F	H	H	CH	-CO-	amorphous
b-21		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-22		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil

[0263] [表24]

化合物番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ^b	R ^c	R ^d	E	-X-	物性
b-23		=O		-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	viscous oil
b-24		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	87-89
b-25		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	
b-26		-OH	-CH ₃	-CH ₃	F	H	H	CH	-O-	

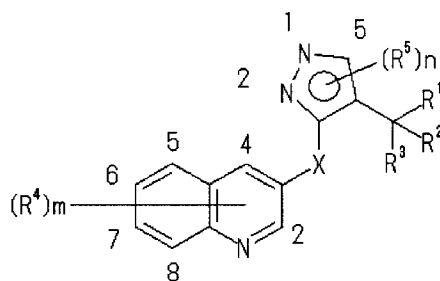
[0264]

[表25]



化合物番号	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	-X-	物性
c-1	8-F	=O		-OCH ₃	-O-	
c-2	8-F	=O		-H	-O-	135-137
c-3	8-F	=O		-CH ₃	-O-	138-139
c-4	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	-O-	129-131
c-5	8-F	-OH	-H	-CH ₃	-O-	96-98

[0265] [表26]



化合物番号	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	(R ⁵) _n	-X-	物性
d-1	8-F	=O		-OCH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-2	8-F	=O		-H	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-3	8-F	=O		-CH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-4	8-F	-OH	-H	-CH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	160-162
d-5	8-F	-OCH ₃	-H	-CH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	n _D ²⁰ _D 1.5056
d-6	8-F	-OH	-H	-iPr	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-7	8-F	-OH	-H	- ⁿ Pr	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-8	8-F	-OH	-H	-CF ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-9	8-F	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ OH	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-10	8-F	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ -COCH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	
d-11	8-F	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ -CO ₂ CH ₃	2-CH ₃ 5-CF ₃	-O-	

[0266]

[表27]

化合物番号	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	(R ⁵) _n	-X-	物性
d-12	8-F	-OH	-H	-CH ₂ Ph	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-13	8-F	-OH	-H	-CH=CH ₂	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-14	8-F	-OH	-H	-C≡CH	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-15	8-F	-OH	-H	-COCH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-16	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-17	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-Pr	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-18	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	- ⁱ Pr	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-19	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CF ₃	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-20	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-O(CH ₂) ₂ OH	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-21	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-CH=CH ₂	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-22	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-H	-C≡CH	2-CH ₃ , 5-CF ₃	-O-	
d-23	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-24	8-F	-OH	-CH ₃	-Pr	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-25	8-F	-OH	-CH ₃	- ⁱ Pr	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-26	8-F	-OH	-CH ₃	-CF ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-27	8-F	-OH	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-28	8-F	-OH	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -COCH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-29	8-F	-OH	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ -CO ₂ CH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-30	8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₂ Ph	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-31	8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-32	8-F	-OH	-CH ₃	-C≡CH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-33	8-F	-OH	-CH ₃	-COCH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-34	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-35	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-Pr	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	

[0267] [表28]

化合物番号	(R ⁴) _m	R ¹	R ²	R ³	(R ⁵) _n	-X-	物性
d-36	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	- ⁱ Pr	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-37	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CF ₃	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-38	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-O(CH ₂) ₂ OH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-39	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-CH=CH ₂	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	
d-40	2-CH ₃ , 8-F	-OH	-CH ₃	-C≡CH	2-CH ₃ , 5-Cl	-O-	

[0268]

[表29]

化合物番号	¹ H-NMR
3	1.16(t, 3H), 4.23(q, 2H), 7.13(d, 1H), 7.29-7.64(m, 6H), 8.02(m, 1H), 8.08(d, 1H), 8.83(d, 1H).
5	1.19(t, 3H), 4.24(q, 2H), 6.80(m, 1H), 7.01(m, 1H), 7.43(d, 1H), 7.50-7.71(m, 3H), 8.04-8.16(m, 2H), 8.83(br, 1H).
7	1.22(t, 3H), 4.31(q, 2H), 6.79(d, 1H), 6.99(t, 1H), 7.38(m, 1H), 7.51-7.72(m, 4H), 8.11(d, 1H), 8.81(d, 1H).
8	1.20(t, 3H), 4.32(q, 2H), 6.85(d, 1H), 7.03(t, 1H), 7.30-7.54(m, 5H), 8.85(d, 1H).
9	7.03(d, 1H), 7.27(d, 1H), 7.30-7.77(m, 6H), 8.12(d, 1H), 8.81(d, 1H).
10	2.61(s, 3H), 6.79(m, 1H), 7.01(t, 1H), 7.31-7.43(m, 2H), 7.47-7.50(m, 2H), 7.58(m, 1H), 8.83(d, 1H).
11	1.28(s, 9H), 6.97(d, 1H), 7.17-7.26(m, 2H), 7.26(m, 1H), 7.52(t, 1H), 7.56(d, 1H), 7.63(m, 1H), 7.69(d, 1H), 8.09(d, 1H), 8.77(d, 1H).
12	1.28(s, 9H), 6.76(d, 1H), 6.98(t, 1H), 7.27-7.50(m, 4H), 7.59(m, 1H), 8.87(d, 1H).
13	7.13(m, 1H), 7.54(m, 1H), 7.69(m, 1H), 7.79(m, 1H), 7.96-8.04(m, 2H), 8.14(d, 1H), 8.25(br, 1H), 8.83(d, 1H).
14	1.35(d, 9H), 6.82(d, 1H), 7.03-7.14(m, 2H), 7.38-7.56(m, 5H), 8.02(d, 1H), 8.73(s, 1H).
17	0.71(t, 3H), 1.39(s, 6H), 1.84(q, 2H), 6.90(m, 1H), 7.12-7.23(m, 2H), 7.41(d, 1H), 7.43-7.68(m, 4H), 8.10(d, 1H), 8.80(br, 1H).
18	0.66(t, 3H), 1.37(s, 6H), 1.85(q, 2H), 6.64(d, 1H), 6.84-6.93(m, 2H), 7.07(m, 1H), 7.15-7.26(m, 2H), 7.41-7.47(m, 2H), 8.82(d, 1H).
22	2.98(s, 3H), 3.12(s, 3H), 6.88(d, 1H), 7.20(t, 1H), 7.41(d, 1H), 7.54(t, 1H), 7.63-7.73(m, 3H), 8.10(d, 1H), 8.79(d, 1H).
24	2.19(s, 3H), 3.89(s, 3H), 7.03(d, 1H), 7.26(m, 1H), 7.36-7.43(m, 2H), 7.48-7.55(m, 2H), 7.59-7.67(m, 2H), 8.09(d, 1H), 8.81(d, 1H).
25	1.18(s, 9H), 2.18(s, 3H), 7.05(d, 1H), 7.26(m, 1H), 7.35-7.64(m, 6H), 8.08(d, 1H), 8.80(d, 1H).
27	1.73(s, 3H), 3.17(s, 6H), 6.98(d, 1H), 7.19(t, 1H), 7.29(m, 1H), 7.48-7.68(m, 4H), 7.82(dd, 1H), 8.08(d, 1H), 8.79(d, 1H).
28	0.20(s, 9H), 1.76(d, 1H), 4.57(br, 1H), 6.62(d, 1H), 6.92(m, 1H), 7.15(m, 1H), 7.33(m, 1H), 7.33(m, 1H), 7.46-7.51(m, 2H), 7.70(s, 1H), 8.83(br, 1H).
30	1.06(s, 9H), 1.76(d, 1H), 4.57(br, 1H), 6.62(d, 1H), 6.92(m, 1H), 7.15(m, 1H), 7.33(m, 1H), 7.46-7.51(m, 2H), 7.70(s, 1H), 8.83(br, 1H).
31	1.03(s, 9H), 1.60(s, 1H), 1.68(s, 3H), 6.86(m, 1H), 7.13-7.24(m, 2H), 7.51-7.71(m, 5H), 8.11(d, 1H), 8.79(d, 1H).
34	1.70(s, 3H), 2.22-2.37(m, 2H), 2.43(br, 1H), 2.91(m, 1H), 3.08(m, 1H), 6.72(d, 1H), 7.07(d, 1H), 7.24(t, 1H), 7.32(m, 1H), 7.45-7.49(m, 2H), 7.59(m, 1H), 8.88(d, 1H).
35	1.07(s, 9H), 2.13(m, 1H), 2.65(m, 1H), 2.93-2.99(m, 3H), 6.69(d, 1H), 7.03(d, 1H), 7.19(t, 1H), 7.33(m, 1H), 7.45-7.52(m, 2H), 7.67(m, 1H), 8.85(d, 1H).

[0269]

[表30]

化合物番号	¹ H-NMR
36	1.75(d, 6H), 3.79(d, 1H), 6.69(m, 1H), 6.958m, 1H), 7.20(m, 1H), 7.35(m, 1H), 7.45-7.51(m, 2H), 7.59(d, 1H), 8.83(d, 1H)
37	1.76(d, 6H), 2.80(s, 3H), 3.87(br, 1H), 6.58(d, 1H), 6.93(m, 1H), 7.19(m, 1H), 7.29-7.45(m, 4H)
38	1.70(s, 6H), 3.01(br, 1H), 6.87(d, 1H), 7.15-7.25(m, 2H), 7.54(t, 1H), 7.60-7.71(m, 4H), 8.12(d, 1H), 8.81(d, 1H)
39	1.28(s, 9H), 7.03(s, 1H), 7.36(d, 1H), 7.52-7.72(m, 4H), 7.95(d, 1H), 8.13(d, 1H), 8.87(d, 1H), 10.42(s, 1H)
40	1.64(s, 6H), 2.53(s, 1H), 7.12(m, 1H), 7.21-7.32(m, 2H), 7.50-7.67(m, 4H), 8.11(d, 1H), 8.85(d, 1H)
41	1.70(s, 6H), 2.77(s, 1H), 6.56(m, 1H), 6.86(m, 1H), 7.54-7.75(m, 5H), 8.13(d, 1H), 8.80(d, 1H)
42	1.68(s, 6H), 2.88(s, 1H), 6.84-6.97(m, 2H), 7.44(m, 1H), 7.52-7.57(m, 2H), 7.62-7.71(m, 2H), 8.12(d, 1H), 8.79(d, 1H)
43	1.77(d, 6H), 4.00(d, 1H), 6.66(m, 1H), 6.90(m, 1H), 8.18(m, 1H), 8.53-7.73(m, 4H), 8.12(d, 1H), 8.79(d, 1H)
46	1.43(t, 3H), 1.72(s, 6H), 2.95(s, 1H), 3.14(q, 2H), 6.80(d, 1H), 7.16-7.25(m, 2H), 7.43-7.48(m, 2H), 7.60-7.67(m, 3H), 8.07(d, 1H)
47	0.94(t, 3H), 1.16(m, 2H), 1.72(s, 6H), 1.87(m, 2H), 2.92(s, 1H), 3.10(t, 2H), 6.81(d, 1H), 7.14-7.23(m, 2H), 7.43-7.48(m, 2H), 7.59-7.67(m, 3H), 8.07(d, 1H)
48	0.93(t, 3H), 1.72(d, 3H), 1.95(m, 1H), 2.08(m, 1H), 3.87(d, 1H), 6.68(d, 1H), 6.95(m, 1H), 7.21(m, 1H), 7.36(m, 1H), 7.44-7.51(m, 2H), 7.59(m, 1H), 8.82(d, 1H)
49	1.75(d, 6H), 3.76(d, 1H), 6.69(m, 1H), 6.94(m, 1H), 7.20(m, 1H), 7.47(m, 1H), 7.59-7.66(m, 2H), 7.78(dd, 1H), 8.90(d, 1H)
51	6.81-6.84(m, 1H), 7.39-7.64(m, 8H), 7.72-7.76(m, 3H), 7.99(d, 1H), 8.07(d, 1H), 8.89(d, 1H), 10.29(s, 1H)
53	1.19(t, 3H), 4.25(q, 2H), 4.31(s, 2H), 7.04(d, 1H), 7.32-7.53(m, 5H), 7.86(s, 1H), 8.84(d, 1H)
59	0.94(s, 6H), 1.26(s, 6H), 2.45(s, 3H), 3.91(s, 2H), 7.03(m, 1H), 7.28-7.37(m, 3H), 7.40(m, 1H), 7.53(d, 1H), 7.61(t, 1H), 7.80-7.88(m, 4H), 8.16(d, 1H), 8.40(d, 1H), 9.27(d, 1H)
60	1.37(s, 6H), 1.98(t, 1H), 2.98(t, 1H), 6.72(d, 1H), 7.08(d, 1H), 7.17(t, 1H), 7.47-7.65(m, 3H), 8.02(dd, 1H)
61	6.96(m, 1H), 7.16-7.32(m, 2H), 7.39-7.49(m, 3H), 7.57(m, 1H), 7.99(d, 1H), 8.45(br, 1H)
67	1.72(s, 6H), 2.77(s, 3H), 3.01(br, 1H), 6.79(d, 1H), 7.13-7.25(m, 2H), 7.43-7.49(m, 2H), 7.59-7.67(m, 3H), 8.05(d, 1H)
68	1.43(d, 6H), 1.73(s, 6H), 3.01(s, 1H), 3.64(m, 1H), 6.78(d, 1H), 7.12-7.25(m, 2H), 7.41-7.46(m, 2H), 7.58-7.65(m, 3H), 8.08(d, 1H)
69	1.70(s, 3H), 3.57(s, 1H), 4.11(s, 3H), 6.83(d, 1H), 7.11-7.23(m, 2H), 7.38(t, 1H), 7.54-7.62(m, 4H), 7.88(d, 1H)

[0270]

[表31]

化合物番号	¹ H-NMR
70	1.35 (t, 3H), 1.71 (s, 6H), 3.61 (s, 1H), 4.56 (d, 2H), 6.84 (d, 1H), 7.11–7.20 (m, 2H), 7.39 (t, 1H), 7.53–7.63 (m, 4H), 7.85 (d, 1H).
72	1.26 (s, 3H), 1.36 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.17 (s, 1H), 4.01 (s, 1H), 6.89 (d, 1H), 7.17–7.28 (m, 2H), 7.54 (t, 1H), 7.60–7.71 (m, 4H), 8.11 (d, 1H), 8.78 (d, 1H).
73	1.15 (t, 3H), 1.86 (s, 3H), 3.80 (s, 1H), 3.94–4.08 (m, 2H), 6.95 (d, 1H), 7.23–7.37 (m, 2H), 7.49–7.55 (m, 2H), 7.61–7.71 (m, 3H), 8.10 (d, 1H), 8.72 (d, 1H).
74	2.04 (s, 3H), 4.27 (s, 1H), 6.60 (d, 1H), 6.94–7.04 (m, 3H), 7.10–7.46 (m, 8H), 8.31 (d, 1H).
75	1.84 (d, 3H), 3.12 (d, 1H), 3.36 (d, 1H), 4.17 (d, 1H), 6.50 (d, 1H), 6.89–7.50 (m, 11H), 8.51 (d, 1H).
76	1.83 (d, 3H), 3.92 (d, 1H), 5.01 (d, 1H), 5.16 (d, 1H), 6.25 (dd, 1H), 6.69 (d, 1H), 6.95 (dd, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.33 (m, 1H), 7.47–7.50 (m, 2H), 7.56 (d, 1H), 8.76 (d, 1H).
77	1.74 (d, 3H), 2.62 (m, 1H), 2.89 (m, 1H), 3.87 (d, 1H), 5.10 (d, 1H), 5.78 (m, 1H), 6.69 (d, 1H), 6.94 (dd, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.33 (m, 1H), 7.48–4.50 (m, 2H), 7.58 (d, 1H), 8.82 (d, 1H).
78	1.84 (d, 3H), 3.97 (d, 1H), 5.03 (d, 1H), 5.17 (d, 1H), 5.71 (dd, 1H), 6.27 (dd, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.76 (dd, 1H), 6.93 (dd, 1H), 7.16–7.42 (m, 5H), 7.46 (d, 1H).
79	1.73 (d, 3H), 2.62 (m, 1H), 2.86 (m, 1H), 3.89–3.95 (m, 3H), 5.07–5.20 (m, 4H), 5.82 (m, 1H), 6.18 (m, 1H), 6.64 (d, 1H), 6.94 (dd, 1H), 7.16–7.41 (m, 5H).
80	0.95 (d, 3H), 0.99 (d, 3H), 1.67 (d, 3H), 2.90 (m, 1H), 3.81 (d, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.94 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.33 (m, 1H), 7.45–7.51 (m, 2H), 7.61 (d, 1H), 8.81 (d, 1H).
81	1.75 (s, 3H), 1.85 (d, 3H), 4.00 (d, 1H), 4.77 (s, 1H), 4.95 (s, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.95 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.48–7.51 (m, 2H), 7.57 (d, 1H), 8.72 (d, 1H).
82	1.81 (d, 3H), 3.09 (d, 1H), 3.35 (d, 1H), 4.13 (s, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.80–7.04 (m, 6H), 7.10–7.51 (m, 4H), 8.65 (d, 1H).
83	1.09 (d, 3H), 1.67–1.70 (m, 3H), 2.84 (t, 2/3H), 2.95 (t, 1/3H), 3.72 (d, 1/3H), 3.94 (d, 2/3H), 4.97–5.10 (m, 2H), 5.78–5.95 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.90–6.96 (m, 1H), 7.16–7.25 (m, 1H), 7.31–7.38 (m, 1H), 7.47–7.50 (m, 2H), 7.59–7.62 (m, 1H), 8.81–8.83 (m, 1H).
86	0.39–0.45 (m, 3H), 0.55 (m, 1H), 1.51 (dd, 1H), 1.73 (d, 3H), 3.74 (d, 1H), 6.68 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.47–7.50 (m, 2H), 7.59 (d, 1H), 8.82 (d, 1H).
87	0.40–0.51 (m, 3H), 0.59 (m, 1H), 1.09 (m, 2H), 1.38 (m, 2H), 1.55 (m, 1H), 1.76 (d, 3H), 2.54 (m, 1H), 4.08 (d, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.91 (dd, 1H), 7.13–7.40 (m, 4H), 7.45 (s, 1H).
88	0.95 (t, 3H), 1.73 (d, 3H), 1.98 (m, 1H), 2.08 (m, 1H), 2.79 (s, 3H), 3.96 (d, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.92 (m, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.29–7.46 (m, 4H).
89	1.74 (d, 3H), 2.76 (s, 3H), 3.99 (d, 1H), 5.02 (d, 1H), 5.18 (d, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.94 (m, 1H), 7.21 (m, 1H), 7.29–7.42 (m, 4H).
90	0.39–0.47 (m, 3H), 0.58 (m, 1H), 1.50 (m, 1H), 1.74 (d, 3H), 2.80 (s, 3H), 3.85 (d, 1H), 6.59 (d, 1H), 6.95 (m, 1H), 7.18 (m, 1H), 7.28–7.46 (m, 4H).

[0271]

[表32]

化合物番号	¹ H-NMR
91	1.83 (d, 3H), 2.63 (s, 3H), 3.06 (d, 1H), 3.30 (d, 1H), 3.67 (s, 3H), 4.21 (br, 1H), 6.43 (d, 1H), 6.68 (d, 2H), 6.89-6.96 (m, 3H), 7.16 (m, 1H), 7.27-7.41 (m, 4H).
92	1.82 (d, 3H), 2.64 (s, 3H), 3.10 (d, 1H), 3.34 (d, 1H), 4.25 (br, 1H), 6.45 (d, 1H), 6.81-7.02 (m, 6H), 7.17 (m, 1H), 7.26-7.42 (m, 3H).
94	1.78 (d, 6H), 2.74 (s, 3H), 2.81 (s, 3H), 4.23 (d, 1H), 6.52 (d, 1H), 6.86 (dd, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.37 (t, 1H), 7.48-7.51 (m, 3H).
97	1.81 (s, 6H), 2.82 (s, 3H), 4.02 (s, 1H), 6.80 (dd, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.26-7.32 (m, 3H), 7.37-7.40 (m, 2H).
101	1.68 (s, 6H), 2.40 (s, 3H), 6.82 (d, 1H), 7.07 (m, 1H), 7.2-7.6 (m, 5H), 8.86 (d, 1H).
103	1.82 (s, 6H), 4.12 (s, 1H), 6.86 (dd, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.47-7.56 (m, 2H), 7.62-7.70 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.77 (d, 1H).
105	1.76 (d, 3H), 2.76 (s, 3H), 3.93 (d, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.92 (m, 1H), 7.13-7.27 (m, 2H), 7.35-7.42 (m, 2H), 8.02 (m, 1H).
107	1.78 (d, 6H), 2.75 (s, 3H), 6.55 (m, 1H), 6.89 (m, 1H), 7.14 (m, 1H), 7.4-7.7 (m, 4H), 8.05 (dd, 1H).
108	1.82 (s, 6H), 2.77 (s, 3H), 4.18 (s, 1H), 6.77 (dd, 1H), 7.13 (m, 1H), 7.25-7.35 (m, 2H), 7.46 (m, 1H), 7.59-7.64 (m, 2H), 8.04 (d, 1H).
111	2.62 (s, 3H), 6.75 (d, 1H), 6.96 (t, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.65-7.76 (m, 2H), 8.12 (d, 1H), 8.79 (d, 1H).
113	0.20 (s, 9H), 6.73 (d, 1H), 6.97 (m, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.54-7.77 (m, 4H), 8.12 (d, 1H), 8.71 (d, 1H).
118	1.76 (d, 3H), 2.74 (s, 3H), 3.92 (d, 1H), 6.55 (m, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.41-7.51 (m, 2H), 7.57 (d, 1H), 8.04 (d, 1H).
119	1.77 (d, 6H), 3.88 (d, 1H), 6.63 (m, 1H), 7.04 (m, 1H), 7.53-7.59 (m, 2H), 7.65-7.73 (m, 2H), 8.12 (d, 1H), 8.79 (d, 1H).
126	1.77 (d, 6H), 3.97 (d, 1H), 6.64 (m, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.17 (dt, 1H), 7.36 (dt, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.68-7.77 (m, 2H), 8.80 (d, 1H).
131	2.17-2.25 (m, 2H), 2.83-2.93 (m, 1H), 3.16-3.27 (m, 1H), 3.33 (s, 3H), 4.88 (t, 1H), 6.84 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.48-7.54 (m, 2H), 7.59-7.68 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.85 (d, 1H).
132	1.44 (d, 3H), 3.25 (s, 3H), 4.73 (q, 1H), 6.96-6.99 (m, 1H), 7.26-7.33 (m, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.51 (t, 1H), 7.58-7.66 (m, 3H), 8.10 (d, 1H), 8.82 (d, 1H).
133	0.99 (t, 3H), 2.16-2.25 (m, 1H), 2.88-2.92 (m, 1H), 3.16-3.25 (m, 1H), 3.35-3.43 (m, 1H), 3.48-3.56 (m, 1H), 4.97 (dd, 1H), 6.87 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.29 (t, 1H), 7.46-7.52 (m, 2H), 7.58-7.67 (m, 2H), 8.09 (d, 1H), 8.84 (d, 1H).
134	0.74 (t, 3H), 1.35-1.43 (m, 2H), 2.17-2.25 (m, 2H), 2.89 (m, 1H), 3.22 (m, 1H), 3.29 (m, 1H), 3.44 (m, 1H), 4.98 (m, 1H), 6.85 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.29 (t, 1H), 7.46-7.52 (m, 2H), 7.58-7.67 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.84 (d, 1H).

[0272]

[表33]

化合物番号	¹ H-NMR
135	0.87 (t, 3H), 1.43 (d, 3H), 1.54 (m, 2H), 3.28 (m, 2H), 4.81 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 7.26-7.30 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.51 (m, 1H), 7.59-7.66 (m, 3H), 8.10 (d, 1H), 8.82 (d, 1H).
136	1.00 (s, 9H), 1.99 (br, 1H), 4.89 (d, 1H), 6.91 (d, 1H), 7.23 (m, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.60-7.68 (m, 4H), 8.10 (d, 1H), 8.80 (d, 1H).
137	2.11 (m, 1H), 2.49 (m, 1H), 2.85 (br, 1H), 2.91 (m, 1H), 3.20 (m, 1H), 5.50 (m, 1H), 6.76 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 7.26 (t, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.55-7.71 (m, 3H), 8.13 (d, 1H), 8.82 (s, 1H).
140	1.60 (d, 3H), 3.24 (s, 3H), 4.86 (q, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.01 (t, 1H), 7.25-7.35 (m, 2H), 7.42-7.50 (m, 3H), 8.83 (d, 1H).
142	1.61 (d, 3H), 3.18 (s, 3H), 5.08 (q, 1H), 6.94 (dd, 1H), 7.15 (t, 1H), 7.27-7.37 (m, 2H), 7.41-7.49 (m, 2H), 8.81 (d, 1H).
143	0.44-0.67 (m, 4H), 1.62 (m, 1H), 2.86 (d, 1H), 4.57 (t, 1H), 6.84 (dd, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.26 (m, 1H), 7.34 (m, 1H), 7.47-7.50 (m, 2H), 7.61 (d, 1H), 8.86 (d, 1H).
145	1.10 (s, 9H), 3.32 (d, 1H), 5.18 (d, 1H), 6.76 (dd, 1H), 7.14 (t, 1H), 7.24 (m, 1H), 7.37 (m, 1H), 7.47-7.53 (m, 2H), 7.71 (d, 1H), 8.83 (d, 1H).
146	1.65 (d, 3H), 2.99 (d, 1H), 5.50 (m, 1H), 6.81 (d, 1H), 7.15-7.27 (m, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.48-7.50 (m, 2H), 7.60 (m, 1H), 8.86 (d, 1H).
147	1.62 (d, 3H), 3.20 (s, 3H), 5.07 (q, 1H), 6.91 (dd, 1H), 7.22-7.35 (m, 3H), 7.41-7.49 (m, 3H), 8.81 (d, 1H).
148	1.65 (d, 3H), 3.00 (d, 1H), 5.47 (m, 1H), 6.84 (d, 1H), 7.10 (t, 1H), 7.30-7.51 (m, 4H), 7.61 (d, 1H), 8.86 (d, 1H).
149	1.61 (d, 3H), 3.19 (s, 3H), 5.06 (q, 1H), 6.96 (d, 1H), 7.17 (t, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.43-7.51 (m, 4H), 8.81 (d, 1H).
150	1.50 (d, 3H), 2.54 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 4.92 (q, 1H), 6.84 (d, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.26-7.34 (m, 2H), 7.38-7.46 (m, 2H), 8.84 (d, 1H).
152	1.61 (d, 3H), 2.83 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 5.05 (q, 1H), 6.85 (dd, 1H), 7.21-7.32 (m, 4H), 7.34-7.40 (m, 2H).
153	1.63 (d, 3H), 3.29 (s, 3H), 4.97 (q, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.32-7.51 (m, 5H), 7.61 (d, 1H), 8.83 (d, 1H).
154	1.62 (d, 3H), 3.22 (s, 3H), 4.09 (s, 3H), 5.08 (q, 1H), 6.91 (d, 1H), 6.97 (m, 1H), 7.13 (t, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.41-7.47 (m, 3H), 8.76 (d, 1H).
155	1.58 (d, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 4.09 (s, 3H), 5.00 (q, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.21-7.28 (m, 2H), 7.39-7.4 (m, 2H), 8.78 (br, 1H).
156	1.63 (d, 3H), 3.82 (d, 2H), 4.98 (dd, 1H), 5.15 (dd, 1H), 5.21 (q, 1H), 5.70 (m, 1H), 6.92 (dd, 1H), 7.24-7.33 (m, 3H), 7.39-7.49 (m, 3H), 8.82 (d, 1H).
157	1.02 (t, 3H), 1.92-2.08 (m, 2H), 2.84 (d, 1H), 5.23 (m, 1H), 6.80 (dd, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.24 (m, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.60 (m, 1H), 8.84 (d, 1H).

[0273]

[表34]

化合物番号	¹ H-NMR
160	1.65 (d, 3H), 4.33 (d, 1H), 4.38 (d, 1H), 5.25 (d, 1H), 6.93 (dd, 1H), 7.13 (m, 5H), 7.25-7.42 (m, 6H), 8.79 (d, 1H).
161	6.56 (d, 1H), 6.78 (m, 1H), 7.2-7.5 (m, 11H), 8.50 (d, 1H).
163	0.85 (t, 3H), 1.2-1.4 (m, 4H), 1.9-2.1 (m, 2H), 2.90 (d, 1H), 5.31 (m, 1H), 6.80 (dd, 1H), 7.1-7.6 (m, 6H), 8.83 (d, 1H).
164	2.25 (m, 1H), 3.53 (d, 1H), 6.07 (dd, 1H), 6.86 (m, 1H), 7.2-7.7 (m, 6H), 8.85 (d, 1H).
165	0.13 (s, 9H), 6.45 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.29-7.38 (m, 3H), 7.48-7.50 (m, 2H), 7.59 (m, 1H), 8.86 (d, 1H).
167	1.62 (d, 3H), 3.20 (s, 3H), 5.08 (q, 1H), 6.91 (dd, 1H), 7.21-7.34 (m, 3H), 7.42-7.47 (m, 3H), 8.81 (d, 1H).
168	3.51 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 5.44 (s, 1H), 6.89 (m, 1H), 7.2-7.6 (m, 6H), 8.78 (d, 1H).
170	0.02 (s, 9H), 2.26 (s, 3H), 5.52 (s, 1H), 6.86 (dd, 1H), 7.2-7.6 (m, 6H), 8.75 (d, 1H).
171	2.22 (s, 3H), 4.13 (d, 1H), 5.66 (d, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.3-7.6 (m, 6H), 8.76 (d, 1H).
172	2.34 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 5.28 (s, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.2-7.26 (m, 6H), 8.81 (d, 1H).
173	1.26 (s, 3H), 1.45 (s, 3H), 3.67 (d, 1H), 5.27 (d, 1H), 6.83 (d, 1H), 7.1-7.5 (m, 6H), 7.66 (bs, 1H), 8.82 (d, 1H).
174	2.97 (d, 1H), 3.31 (m, 2H), 5.59 (m, 1H), 6.75 (d, 1H), 7.13-7.49 (m, 11H), 8.77 (br, 1H).
175	3.19 (s, 3H), 3.28-3.44 (m, 2H), 5.18 (t, 1H), 6.82 (d, 1H), 7.11-7.49 (m, 11H), 8.67 (br, 1H).
177	1.60 (d, 3H), 3.17 (s, 3H), 5.04 (q, 1H), 6.97 (dd, 1H), 7.13 (t, 1H), 7.26-7.36 (m, 2H), 7.42-7.49 (m, 2H), 8.81 (d, 1H).
180	1.23 (s, 3H), 1.40 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 4.87 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.26-7.35 (m, 3H), 7.45-7.48 (m, 3H), 8.75 (d, 1H).
181	3.59 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 5.79 (d, 1H), 6.8-6.95 (m, 1H), 7.2-7.6 (m, 6H), 8.77 (d, 1H).
185	1.71 (t, 3H), 3.06 (m, 1H), 5.34 (m, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.32-7.41 (m, 2H), 7.49-7.52 (m, 3H), 7.67 (dd, 1H), 8.86 (d, 1H).
186	1.67 (d, 3H), 3.16 (s, 3H), 4.85 (q, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.32 (m, 1H), 7.41-7.47 (m, 4H), 7.58 (d, 1H), 8.80 (d, 1H).
188	1.63 (d, 3H), 3.23 (s, 3H), 5.10 (q, 1H), 6.89 (dd, 1H), 7.18-7.29 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.60-7.69 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.78 (d, 1H).
189	1.48 (d, 3H), 1.97 (d, 1H), 5.17 (m, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.24-7.35 (m, 2H), 7.45-7.52 (m, 2H), 7.58-7.63 (m, 2H), 8.09 (d, 1H), 8.87 (d, 1H).
190	1.61 (d, 3H), 2.69 (m, 1H), 5.43 (m, 1H), 7.09 (t, 1H), 7.27-7.34 (m, 2H), 7.52 (t, 1H), 7.60-7.67 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.87 (d, 1H).
198	1.61 (d, 3H), 2.83 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 5.04 (q, 1H), 6.84 (dd, 1H), 7.19-7.36 (m, 5H).

[0274]

[表35]

化合物番号	¹ H-NMR
203	1.62 (d, 3H), 3.22 (s, 3H), 5.09 (q, 1H), 6.87 (dd, 1H), 7.1-7.4 (m, 3H), 7.46 (d, 1H), 7.6-7.8 (m, 2H), 8.78 (d, 1H)
204	1.78 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.14 (d, 1H), 5.85 (d, 1H), 6.93 (m, 1H), 7.2-7.5 (m, 6H), 8.78 (d, 1H)
206	1.77 (d, 1H), 2.71 (s, 3H), 5.52 (m, 1H), 6.24 (dd, 1H), 6.83 (m, 1H), 7.07 (m, 1H), 7.42-7.77 (m, 2H), 7.80 (m, 1H)
207	1.52 (dd, 3H), 2.29 (s, 6H), 3.95 (q, 1H), 6.78 (d, 1H), 6.97 (m, 1H), 7.23-7.34 (m, 2H), 7.43-7.47 (m, 3H), 8.84 (d, 1H)
209	1.60 (d, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 4.82 (q, 1H), 7.0-7.1 (m, 1H), 7.2-7.5 (m, 6H), 8.84 (d, 1H)
210	1.59 (d, 3H), 2.59 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 4.76 (q, 1H), 6.99 (dd, 1H), 7.11 (dd, 1H), 7.2-7.5 (m, 5H), 8.85 (d, 1H)
211	1.60 (d, 3H), 2.51 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 5.04 (q, 1H), 6.78 (dd, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.2-7.5 (m, 5H), 8.83 (d, 1H)
212	1.74 (d, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.26 (s, 3H), 5.48 (q, 1H), 7.2-7.5 (m, 5H), 8.03 (d, 1H), 8.81 (d, 1H)
215	1.60 (d, 3H), 3.02 (s, 3H), 4.48 (q, 1H), 7.02 (dd, 1H), 7.12 (dd, 1H), 7.2-7.55 (m, 10H), 8.85 (d, 1H)
217	3.42 (s, 6H), 5.65 (s, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.01 (t, 1H), 7.29-7.37 (m, 2H), 7.45-7.48 (m, 3H), 8.86 (d, 1H)
218	1.11 (t, 6H), 3.49 (m, 2H), 3.74 (m, 2H), 5.78 (s, 1H), 6.80 (d, 1H), 7.01 (t, 1H), 7.27-7.36 (m, 2H), 7.43-7.49 (m, 3H), 8.86 (d, 1H)
220	3.35 (s, 3H), 4.66 (s, 2H), 6.92 (dd, 1H), 7.29-7.35 (m, 3H), 7.44-7.46 (m, 3H), 8.88 (d, 1H)
221	3.99 (m, 2H), 4.70 (s, 2H), 5.08 (d, 1H), 5.17 (d, 1H), 5.78 (m, 1H), 6.93 (dd, 1H), 7.28-7.35 (m, 3H), 7.44-7.49 (m, 3H), 8.88 (d, 1H)
223	3.36 (s, 3H), 4.66 (s, 2H), 6.96 (d, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.33 (m, 1H), 7.45-7.52 (m, 3H), 8.88 (d, 1H)
224	0.83 (t, 3H), 1.30 (m, 2H), 1.40 (m, 2H), 2.60 (t, 2H), 3.99 (s, 2H), 6.90 (d, 1H), 7.20-7.37 (m, 3H), 7.44-7.50 (m, 3H), 8.87 (d, 1H)
225	0.99 (s, 6H), 1.48 (s, 6H), 1.63 (d, 1H), 3.57 (d, 1H), 6.93 (d, 1H), 7.14-7.26 (m, 2H), 7.44-7.71 (m, 5H), 8.09 (d, 1H), 8.77 (br, 1H)
226	0.95 (s, 6H), 1.42 (s, 6H), 2.43 (s, 3H), 4.01 (s, 2H), 6.87 (d, 1H), 7.11 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 7.28 (d, 2H), 7.40-7.54 (m, 3H), 7.59-7.74 (m, 4H), 8.10 (d, 1H), 8.68 (d, 1H)
227	1.23 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 2.49 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.18-7.26 (m, 2H), 7.49-7.68 (m, 5H), 8.10 (d, 1H), 8.77 (d, 1H)
230	0.87 (s, 3H), 1.04 (s, 3H), 1.22 (d, 3H), 1.52 (d, 6H), 1.68 (d, 1H), 4.08 (m, 1H), 6.94 (m, 1H), 7.15-7.26 (m, 2H), 7.46-7.54 (m, 2H), 7.59-7.68 (m, 3H), 8.10 (d, 1H), 8.78 (d, 1H)
232	1.38 (s, 6H), 1.65 (s, 6H), 6.95 (m, 1H), 7.19-7.31 (m, 2H), 7.47 (d, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.60-7.69 (m, 3H), 8.10 (d, 1H), 8.75 (d, 1H)

[0275]

[表36]

化合物番号	¹ H-NMR
234	1.49 (s, 6H), 6.92 (m, 1H), 7.19-7.33 (m, 2H), 7.48-7.71 (m, 5H), 8.02 (d, 1H), 8.72 (d, 1H), 9.72 (s, 1H)
235	1.05 (s, 6H), 1.57 (s, 6H), 3.64 (d, 1H), 6.73 (d, 1H), 6.87 (m, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.81-7.55 (m, 2H), 7.61-7.73 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.75 (d, 1H)
243	1.08 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 2.26 (s, 2H), 6.88 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.36 (s, 2H), 7.50-7.70 (m, 4H), 8.81 (d, 1H), 8.91 (d, 1H)
244	1.02 (br, 1H), 1.46 (s, 6H), 2.19 (t, 2H), 3.56 (m, 2H), 6.90 (d, 1H), 7.13-7.24 (m, 2H), 7.43 (d, 1H), 7.49-7.54 (m, 2H), 7.60-7.70 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.81 (d, 1H)
246	1.06 (d, 3H), 1.50 (d, 6H), 1.96 (dd, 1H), 2.15 (dd, 1H), 3.83 (m, 1H), 6.89 (dd, 1H), 7.13-7.26 (m, 2H), 7.46-7.55 (m, 2H), 7.59-7.70 (m, 3H), 8.11 (d, 1H), 8.82 (d, 1H)
247	1.47 (s, 6H), 2.21 (d, 2H), 3.16 (s, 6H), 4.19 (t, 1H), 6.87 (dd, 1H), 7.13-7.20 (m, 2H), 7.44 (m, 1H), 7.49 (t, 1H), 7.54-7.70 (m, 3H), 8.10 (d, 1H), 8.81 (d, 1H)
248	0.99 (s, 6H), 1.49 (s, 6H), 3.43 (s, 6H), 3.95 (s, 1H), 6.93 (d, 1H), 7.12-7.24 (m, 2H), 7.42 (d, 1H), 7.48-7.67 (m, 4H), 8.09 (d, 1H), 8.78 (d, 1H)
251	1.26 (s, 6H), 1.56 (s, 6H), 2.48 (s, 1H), 2.79 (s, 1H), 6.88 (m, 1H), 7.19-7.30 (m, 3H), 7.43 (t, 1H), 7.56-7.61 (m, 3H), 8.02 (d, 1H)
252	0.97 (t, 1H), 1.47 (s, 6H), 2.19 (t, 2H), 2.84 (s, 3H), 3.57 (m, 1H), 6.83 (dd, 1H), 7.11-7.23 (m, 2H), 7.37 (s, 1H), 7.41-7.46 (m, 2H), 7.56-7.62 (m, 2H), 8.02 (d, 1H)
253	1.09 (d, 3H), 1.40 (s, 3H), 1.45 (s, 3H), 1.72 (bs, 1H), 4.54 (m, 1H), 6.89 (dd, 1H), 7.1-7.3 (m, 2H), 7.4-7.7 (m, 5H), 8.09 (d, 1H), 8.77 (d, 1H)
254	0.91 (t, 3H), 1.2-1.5 (m, 8H), 1.6-1.7 (m, 1H), 4.1-4.2 (m, 1H), 6.90 (dd, 1H), 7.1-7.3 (m, 2H), 7.4-7.7 (m, 5H), 8.10 (d, 1H), 8.77 (d, 1H)
255	1.43 (s, 3H), 1.49 (s, 3H), 1.57 (s, 3H), 1.75 (d, 1H), 4.8-5.0 (m, 3H), 6.91 (dd, 1H), 7.1-7.3 (m, 2H), 7.4-7.7 (m, 5H), 8.10 (d, 1H), 8.81 (d, 1H)
256	0.89 (s, 3H), 1.05-1.10 (m, 6H), 1.23 (br, 6H), 2.81 (s, 3H), 4.09 (m, 1H), 6.88 (d, 1H), 7.18-7.26 (m, 3H), 7.42 (t, 1H), 7.55-7.64 (m, 3H), 8.01 (d, 1H)
257	1.24 (s, 6H), 1.53 (br, 6H), 1.88 (s, 3H), 2.83 (s, 3H), 6.87 (d, 1H), 7.13-7.26 (m, 3H), 7.41-7.46 (m, 2H), 7.56-7.60 (m, 2H), 8.03 (d, 1H)
258	1.11 (br, 1H), 1.45 (s, 6H), 2.37 (t, 2H), 3.55 (m, 2H), 6.90 (m, 1H), 7.15-7.34 (m, 3H), 7.42-7.46 (m, 3H), 7.53 (d, 1H), 8.84 (d, 1H)
259	0.98 (br, 1H), 1.46 (s, 6H), 2.17 (t, 2H), 2.86 (s, 3H), 3.57 (m, 2H), 6.86 (d, 1H), 7.15-7.30 (m, 3H), 7.36-7.37 (m, 3H), 7.45 (m, 1H)
260	1.51 (s, 6H), 2.11 (s, 3H), 6.91 (dd, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H), 7.5-7.7 (m, 5H), 8.11 (d, 1H), 8.71 (d, 1H)
261	1.47 (s, 6H), 2.28 (t, 2H), 2.84 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 4.04 (t, 2H), 6.84 (m, 1H), 7.12-7.28 (m, 3H), 7.30-7.45 (m, 4H)

[0276]

[表37]

化合物番号	¹ H-NMR
262	1.59 (s, 6H), 2.18 (s, 3H), 6.72 (m, 1H), 6.96 (m, 1H), 7.2-7.6 (m, 5H), 8.73 (d, 1H).
263	1.3 (s, 6H), 1.63 (s, 6H), 6.74 (d, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.18 (m, 1H), 7.5-7.8 (m, 4H), 8.10 (d, 1H), 8.75 (d, 1H).
265	1.60 (s, 6H), 2.18 (s, 3H), 6.70 (d, 1H), 6.92 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 7.5-7.8 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.69 (d, 1H).
266	1.59 (d, 6H), 2.18 (s, 3H), 6.68 (d, 2H), 6.92 (dd, 1H), 6.96-7.24 (m, 1H), 7.31-7.37 (m, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.67-7.75 (m, 2H), 8.69 (d, 1H).
267	1.59 (d, 6H), 2.18 (s, 3H), 6.70 (d, 1H), 6.96 (dd, 1H), 7.19-7.25 (m, 1H), 7.40-7.49 (m, 2H), 7.53 (d, 1H), 8.75 (d, 1H).
268	0.87 (d, 3H), 1.39 (s, 3H), 1.44 (s, 3H), 1.85 (s, 1H), 4.50 (m, 1H), 6.91 (d, 1H), 7.16-7.33 (m, 3H), 7.43-7.52 (m, 3H), 8.81 (d, 1H).
269	1.51 (s, 6H), 2.14 (s, 3H), 6.92 (d, 1H), 7.22-7.36 (m, 3H), 7.44-7.48 (m, 2H), 7.50-7.58 (m, 2H), 8.73 (d, 1H).
270	1.88 (s, 6H), 2.86 (s, 3H), 6.88 (d, 1H), 7.18-7.43 (m, 5H), 7.50-7.56 (m, 2H).
271	1.89 (s, 6H), 6.93 (d, 1H), 7.20 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.54 (t, 1H), 7.63-7.73 (m, 2H), 8.12 (d, 1H), 8.83 (d, 1H).
277	0.82 (t, 3H), 1.20 (t, 3H), 1.64 (m, 1H), 3.04 (m, 1H), 6.98 (m, 1H), 7.19-7.26 (m, 2H), 7.32-7.39 (m, 2H), 7.49 (t, 1H), 7.52-7.65 (m, 2H), 8.10 (d, 1H), 8.83 (br, 1H).
278	0.79 (d, 3H), 0.94 (d, 3H), 1.21 (d, 3H), 1.78-1.90 (m, 1H), 2.80-2.90 (m, 1H), 6.94-6.99 (m, 1H), 7.18-7.4 (m, 2H), 7.35 (d, 1H), 7.49 (t, 1H), 7.58-7.65 (m, 3H), 8.09 (d, 1H), 8.93 (br, 1H).
280	2.24 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 4.13 (d, 1H), 5.51 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 7.02 (t, 1H), 7.2-7.6 (m, 5H).
286	1.73-1.82 (m, 4H), 2.66-2.70 (m, 2H), 2.82-2.84 (m, 2H), 6.82 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 7.13 (t, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.48-7.76 (m, 4H), 8.07-8.14 (m, 2H), 8.83 (d, 1H).
289	1.26 (t, 3H), 4.25 (q, 2H), 6.73 (d, 1H), 7.01 (t, 1H), 7.41 (m, 1H), 7.56 (t, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.66-7.75 (m, 2H), 8.12 (d, 1H), 8.74 (d, 1H).
295	3.13 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 6.76 (d, 1H), 7.03 (m, 1H), 7.31-7.52 (m, 4H), 7.60 (dd, 1H), 8.78 (d, 1H).
297	1.01 (m, 2H), 1.31 (m, 2H), 4.53 (s, 2H), 6.79 (d, 1H), 6.98 (t, 1H), 7.08-7.11 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 3H), 7.28-7.49 (m, 5H), 8.87 (d, 1H).
308	1.66 (s, 3H), 2.93 (d, 1H), 2.99 (d, 1H), 6.74 (d, 1H), 6.95 (t, 1H), 7.26-7.36 (m, 2H), 7.46-7.48 (m, 2H), 7.54 (d, 1H), 8.85 (d, 1H).
328	3.45 (s, 6H), 4.54 (s, 2H), 5.93 (s, 1H), 7.04 (d, 1H), 7.17 (t, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.43 (m, 1H), 7.50 (m, 1H), 7.85 (s, 1H), 8.86 (d, 1H).
329	1.27 (t, 3H), 4.26 (q, 2H), 4.60 (s, 2H), 7.27-7.52 (m, 6H), 7.81 (s, 1H), 7.99 (d, 1H), 8.88 (d, 1H).
330	1.18 (t, 3H), 4.24 (q, 2H), 4.30 (s, 2H), 7.01-7.07 (m, 2H), 7.35 (m, 1H), 7.51 (t, 1H), 7.67 (t, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.85 (s, 1H), 8.07 (d, 1H), 8.78 (d, 1H).

[0277]

[表38]

化合物番号	¹ H-NMR
331	1.15 (t, 3H), 4.09 (q, 2H), 4.28 (s, 2H), 7.02-7.07 (m, 2H), 7.27-7.40 (m, 2H), 7.68-7.83 (m, 2H), 8.16 (d, 1H), 8.78 (d, 1H).
334	5.28-5.61 (m, 2H), 5.83-6.12 (m, 2H), 7.18-7.42 (m, 4H), 7.54-8.10 (m, 4H), 8.47 (dd, 1H), 9.02 (d, 1H).
339	1.55 (d, 3H), 1.68 (d, 3H), 6.14 (s, 1H), 7.32-7.41 (m, 2H), 7.51-7.63 (m, 3H), 7.81-7.88 (m, 2H), 8.16 (d, 1H), 8.44 (d, 1H), 9.24 (d, 1H).
340	7.52-7.67 (m, 5H), 7.83-7.88 (m, 2H), 7.96 (m, 1H), 8.08 (d, 1H), 8.18-8.21 (m, 2H), 8.53 (d, 1H), 9.42 (d, 1H).
343	5.94 (dd, 1H), 6.22 (dd, 1H), 6.89 (dd, 1H), 7.54-7.87 (m, 7H), 8.14 (m, 1H), 8.47 (d, 1H), 9.28 (d, 1H).
344	1.66 (s, 3H), 3.02 (s, 2H), 4.50 (m, 1H), 4.70 (m, 1H), 7.31-7.71 (m, 7H), 8.50 (m, 1H), 9.33 (d, 1H).
345	3.07 (t, 2H), 3.58 (t, 2H), 7.35-7.71 (m, 5H), 7.84-7.91 (m, 2H), 8.19 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 9.36 (d, 1H).
347	1.64 (s, 3H), 3.53 (s, 2H), 4.40 (m, 1H), 4.64 (m, 1H), 7.17 (dd, 1H), 7.26-7.42 (m, 2H), 7.63 (m, 1H), 7.82-7.90 (m, 2H), 8.18 (m, 1H), 8.46 (d, 1H), 9.30 (d, 1H).
350	1.67 (d, 3H), 1.75 (d, 3H), 2.60 (bs, 1H), 5.04 (bs, 1H), 6.54 (s, 1H), 7.02-7.10 (m, 2H), 7.18-7.55 (m, 5H), 8.04 (s, 1H), 8.85 (d, 1H).
351	3.94-4.00 (m, 2H), 5.12-5.26 (m, 3H), 5.75 (d, 1H), 6.09 (m, 1H), 6.49 (dd, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.38-7.53 (m, 3H), 7.69-7.76 (m, 3H), 8.00 (d, 1H), 8.12 (d, 1H), 9.48 (d, 1H).
352	1.17 (t, 3H), 4.20 (q, 2H), 6.94 (d, 1H), 7.31 (t, 1H), 7.55-7.61 (m, 2H), 7.67-7.77 (m, 3H), 8.04 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.80 (br, 1H).
353	2.61 (s, 3H), 6.90 (d, 1H), 7.28-7.38 (m, 3H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.58 (m, 1H), 8.86 (d, 1H).
355	2.61 (s, 3H), 6.93 (d, 1H), 7.23-7.37 (m, 2H), 7.43-7.49 (m, 3H), 7.57 (s, 1H), 8.82 (br, 1H).
359	2.61 (s, 3H), 2.74 (s, 3H), 6.78 (dd, 1H), 7.24-7.46 (m, 5H), 7.46 (s, 1H).
360	1.24 (d, 6H), 3.16 (sep, 1H), 6.88 (d, 1H), 7.2-7.6 (m, 6H), 8.81 (d, 1H).
361	2.60 (s, 3H), 6.93 (dd, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.47-7.51 (m, 3H), 8.83 (d, 1H).
363	1.06 (m, 2H), 1.25 (m, 2H), 2.29 (m, 1H), 6.96 (dd, 1H), 7.29-7.38 (m, 3H), 7.43-7.53 (m, 3H), 8.83 (d, 1H).
364	2.00 (s, 3H), 5.79 (s, 1H), 6.06 (s, 1H), 6.90 (d, 1H), 7.26-7.37 (m, 3H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.57 (m, 1H), 8.78 (br, 1H).
365	1.33 (s, 9H), 6.90 (dd, 1H), 7.26-7.37 (m, 3H), 7.46-7.51 (m, 2H), 7.54 (m, 1H), 8.81 (d, 1H).
367	2.62 (s, 3H), 2.65 (s, 3H), 2.80 (s, 3H), 6.59 (d, 1H), 6.92 (t, 1H), 7.26-7.39 (m, 2H), 7.48-7.51 (m, 3H).
368	6.95 (d, 1H), 7.2-7.7 (m, 10H), 7.87 (m, 1H), 8.64 (d, 1H).
371	0.91 (s, 3H), 1.38 (m, 2H), 1.70 (m, 2H), 2.89 (t, 2H), 6.88 (d, 1H), 7.2-7.6 (m, 6H), 8.82 (d, 1H).
373	6.66 (s, 1H), 6.76 (d, 1H), 7.04 (t, 1H), 7.36-7.56 (m, 4H), 7.73 (d, 1H), 8.84 (d, 1H).

[0278]

[表39]

化合物番号	¹ H-NMR
374	6.79 (d, 1H), 7.04 (t, 1H), 7.35-7.56 (m, 4H), 7.74 (s, 1H), 8.82 (d, 1H).
375	2.46 (s, 3H), 6.86 (d, 1H), 7.2-7.7 (m, 6H), 8.80 (d, 1H).
376	1.57 (s, 6H), 2.7 (bs, 1H), 6.89 (dd, 1H), 7.2-7.7 (m, 6H), 8.82 (d, 1H).
377	1.24 (d, 6H), 3.16 (sep, 1H), 6.88 (d, 1H), 7.2-7.6 (m, 6H), 8.81 (d, 1H).
382	2.59 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 6.69 (d, 1H), 6.99 (t, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.33-7.41 (m, 3H), 8.00 (m, 1H).
383	2.61 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 6.62 (d, 1H), 6.97 (t, 1H), 7.24-7.37 (m, 2H), 7.48 (s, 1H), 7.61-7.69 (m, 2H).
384	2.15 (s, 3H), 5.11 (s, 2H), 6.78 (d, 1H), 7.03 (t, 1H), 7.33-7.53 (m, 4H), 7.64 (d, 1H), 8.84 (d, 1H).
388	2.61 (s, 3H), 6.80 (d, 1H), 7.02 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.39 (m, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 8.81 (d, 1H).
389	2.60 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 6.67 (d, 1H), 6.98 (t, 1H), 7.32-7.45 (m, 3H), 7.58 (d, 1H), 8.03 (s, 1H).
390	6.76 (d, 1H), 7.04 (t, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.47-7.57 (m, 3H), 7.75 (s, 1H), 8.82 (d, 1H).
397	1.53 (bs, 6H), 2.73 (s, 3H), 6.67 (d, 1H), 6.99 (t, 1H), 7.2-7.7 (m, 5H).
398	1.53 (d, 6H), 6.98 (t, 1H), 7.3-7.7 (m, 5H), 8.81 (d, 1H).
401	6.97 (d, 1H), 7.10 (t, 1H), 7.26-7.38 (m, 3H), 7.46-7.75 (m, 7H), 8.14 (d, 1H), 8.35 (d, 1H), 8.91 (d, 1H), 9.36 (s, 1H).
402	3.94 (s, 3H), 6.87 (d, 1H), 7.24-7.35 (m, 2H), 7.56 (t, 1H), 7.61-7.73 (m, 3H), 8.11 (d, 1H), 8.79 (d, 1H).
403	3.89 (s, 3H), 6.92 (d, 1H), 7.26 (t, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.54 (t, 1H), 7.61-7.74 (m, 3H), 8.11 (d, 1H), 8.79 (d, 1H).
409	1.19 (t, 3H), 2.33 (d, 3H), 4.27 (q, 2H), 6.78 (d, 1H), 7.29-7.35 (m, 2H), 7.44-7.48 (m, 3H), 8.84 (d, 1H).
410	1.41 (s, 9H), 6.97 (d, 1H), 7.28-7.38 (m, 3H), 7.45-7.49 (m, 3H), 8.85 (d, 1H).
427	1.33 (d, 3H), 2.80 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 4.00 (m, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.03 (m, 1H), 7.25-7.45 (m, 5H).
428	1.02 (t, 3H), 1.36 (s, 3H), 1.79 (q, 2H), 2.18 (s, 1H), 2.79 (s, 3H), 6.75 (d, 1H), 7.03 (m, 1H), 7.28-7.45 (m, 5H).
430	1.03 (t, 3H), 1.28 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 3.90 (q, 2H), 6.79 (d, 1H), 6.97 (t, 1H), 7.26-7.35 (m, 2H), 7.40-7.50 (m, 3H), 8.83 (d, 1H).
431	0.66-0.87 (m, 2H), 1.12-1.19 (m, 2H), 1.26-1.29 (m, 8H), 1.99 (s, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.89 (m, 1H), 7.18 (m, 1H), 7.34 (m, 1H), 7.47-7.50 (m, 2H), 7.62 (m, 1H), 8.82 (d, 1H).
435	1.82 (d, 6H), 5.28 (br, 2H), 6.62 (d, 1H), 6.87 (dd, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.33 (m, 1H), 7.43-7.51 (m, 2H), 7.68 (m, 1H), 8.79 (d, 1H).
437	1.93 (d, 6H), 6.72 (m, 1H), 6.91-6.98 (m, 2H), 7.19-7.38 (m, 2H), 7.43-7.52 (m, 2H), 7.58 (m, 1H), 8.83 (d, 1H).
442	2.46 (s, 6H), 5.22 (s, 1H), 6.8-7.0 (m, 1H), 7.2-7.5 (m, 5H), 7.67 (dd, 1H), 8.84 (d, 1H).

[0279]

[表40]

化合物番号	¹ H-NMR
443	2.07 (s, 3H), 6.78 (d, 1H), 6.80 (bs, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.2-7.6 (m, 5H), 7.78 (m, 1H), 8.88 (d, 1H).
445	1.54 (dd, 3H), 1.61-1.69 (m, 4H), 2.34-2.39 (m, 2H), 2.54-2.59 (m, 2H), 3.92 (q, 1H), 6.79 (m, 1H), 6.97 (m, 1H), 7.22-7.33 (m, 2H), 7.39 (m, 1H), 7.43-7.47 (m, 2H), 8.83 (d, 1H).
446	1.47 (d, 3H), 1.54 (s, 9H), 3.29 (s, 3H), 4.97 (q, 1H), 6.67 (d, 1H), 7.2-7.5 (m, 5H), 8.04 (d, 1H), 8.66 (bs, 1H), 8.85 (d, 1H).
447	1.50 (d, 3H), 3.26 (s, 3H), 4.88 (bs, 2H), 4.93 (q, 2H), 6.33 (dd, 1H), 6.52 (dd, 1H), 7.07 (t, 1H), 7.2-7.5 (m, 4H), 8.84 (d, 1H).
448	1.47 (d, 3H), 2.89 (d, 3H), 3.23 (s, 3H), 4.94 (q, 2H), 5.78 (bs, 1H), 6.30 (dd, 1H), 6.51 (d, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.24-7.43 (m, 5H), 8.84 (d, 1H).
449	2.11 (br, 6H), 2.84 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 6.68 (m, 1H), 6.96 (m, 1H), 7.27-7.44 (m, 4H), 7.49 (d, 1H).
450	2.11 (d, 6H), 2.91 (s, 3H), 6.74 (m, 1H), 6.97 (m, 1H), 7.29-7.51 (m, 3H), 7.67 (m, 1H), 8.82 (d, 1H).
451	2.16 (br, 6H), 2.81 (s, 3H), 2.92 (s, 3H), 6.65 (d, 1H), 6.98 (m, 1H), 7.26-7.42 (m, 3H), 7.50 (s, 1H).
452	1.38 (t, 3H), 2.11 (s, 6H), 3.08 (q, 2H), 6.76 (d, 1H), 6.98 (m, 1H), 7.30-7.38 (m, 2H), 7.47-7.54 (m, 2H), 7.70 (d, 1H), 8.84 (d, 1H).
453	1.99 (d, 3H), 2.95 (s, 3H), 5.20 (q, 1H), 6.84 (m, 1H), 7.23-7.55 (m, 5H), 7.78 (m, 1H), 8.83 (d, 1H).
a-2	1.67 (s, 6H), 6.00 (s, 1H), 7.54-7.61 (m, 2H), 7.66-7.74 (m, 2H), 8.14 (d, 1H), 8.38 (t, 1H), 8.80 (d, 1H).
a-7	1.66 (s, 6H), 2.81 (s, 3H), 6.02 (s, 1H), 7.19-7.43 (m, 6H), 8.40 (d, 1H).
a-8	1.65 (s, 6H), 5.96 (s, 1H), 7.25-7.39 (m, 3H), 7.48-7.58 (m, 3H), 8.41 (m, 1H), 8.85 (d, 1H).
b-1	1.18 (s, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.75-1.93 (m, 4H), 2.73 (t, 2H), 2.84 (s, 1H), 2.89 (t, 2H), 6.82 (dd, 1H), 6.96 (d, 1H), 7.08-7.20 (m, 2H), 7.49 (dd, 1H), 8.10 (d, 1H).
b-3	1.27 (s, 6H), 1.60 (d, 6H), 1.76-1.94 (m, 4H), 2.49 (s, 1H), 2.74 (t, 2H), 2.90 (t, 2H), 6.62 (d, 1H), 6.79-6.86 (m, 1H), 6.97 (d, 1H), 7.08-7.15 (m, 1H), 8.10 (d, 1H).
b-4	1.19 (s, 6H), 1.50 (s, 6H), 2.11-2.21 (m, 2H), 2.83 (s, 1H), 2.90 (t, 2H), 2.95 (t, 2H), 6.81 (dd, 1H), 7.08-7.21 (m, 3H), 7.50 (dd, 1H), 8.08 (d, 1H).
b-5	1.19 (s, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.62-1.73 (m, 4H), 1.83-1.90 (m, 2H), 2.70-2.73 (m, 2H), 2.92 (s, 1H), 3.00-3.04 (m, 2H), 6.84 (dd, 1H), 7.01 (d, 2H), 7.07-7.20 (m, 2H), 7.48 (dd, 1H), 8.00 (d, 1H).
b-6	1.76-1.95 (m, 4H), 2.59 (s, 3H), 2.75 (t, 2H), 2.91 (t, 2H), 6.63 (d, 1H), 6.88 (t, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.24-7.32 (m, 1H), 8.16 (d, 1H).
b-7	1.74 (d, 6H), 1.74-1.95 (m, 4H), 2.76 (t, 2H), 2.92 (t, 2H), 4.26 (d, 1H), 6.55 (dd, 1H), 6.79-6.86 (m, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.07-7.15 (m, 1H), 8.18 (d, 1H).
b-8	1.03 (s, 9H), 1.71 (d, 3H), 1.74-1.95 (m, 4H), 2.75 (t, 2H), 2.91 (t, 2H), 5.00 (s, 1H), 6.53 (d, 1H), 6.77-6.84 (m, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.08-7.26 (m, 1H), 8.20 (d, 1H).
b-9	1.63 (d, 3H), 1.76-1.95 (m, 4H), 2.75 (t, 2H), 2.77-2.93 (m, 2H), 3.48 (s, 1H), 5.29-5.34 (m, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.81 (dd, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.13 (q, 1H), 8.16 (d, 1H).

[0280]

[表41]

化合物番号	¹ H-NMR
b-10	1.59 (d, 3H), 1.65–1.94 (m, 4H), 2.74 (t, 2H), 2.90 (t, 2H), 3.27 (s, 3H), 4.90 (q, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.84 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 7.14–7.22 (m, 1H), 8.11 (d, 1H).
b-11	2.65 (s, 3H), 6.65 (d, 1H), 6.92 (t, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.27–7.35 (m, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 8.43 (d, 1H).
b-12	1.77 (d, 6H), 4.16 (d, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.86 (dd, 1H), 7.09–7.18 (m, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 8.44 (d, 1H).
b-13	1.17 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 2.92 (s, 3H), 2.92 (t, 2H), 3.41 (s, 1H), 3.48 (t, 2H), 6.78 (d, 1H), 6.91 (d, 1H), 6.92–7.15 (m, 2H), 7.42 (dd, 1H), 7.65 (d, 1H).
b-14	1.67 (d, 3H), 2.75 (dd, 1H), 5.31–5.41 (m, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.87 (m, 1H), 7.12–7.21 (m, 2H), 7.61 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 8.44 (d, 1H).
b-15	1.59 (d, 3H), 3.29 (s, 3H), 4.93 (q, 1H), 6.65 (d, 1H), 6.90 (t, 1H), 7.07–7.25 (m, 2H), 7.58 (d, 1H), 7.64 (s, 1H), 8.41 (d, 1H).
b-16	1.06 (s, 9H), 1.75 (d, 3H), 4.93 (s, 1H), 6.54 (d, 1H), 6.84 (dd, 1H), 7.07–7.12 (m, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 8.45 (d, 1H).
b-19	1.50 (s, 3H), 1.67 (s, 3H), 1.81–1.97 (m, 4H), 2.80 (m, 2H), 2.97 (m, 2H), 5.90 (s, 1H), 7.19–7.37 (m, 3H), 7.72 (m, 1H), 8.55 (d, 1H).
b-20	1.52 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 5.88 (s, 1H), 7.23–7.42 (m, 4H), 7.62 (d, 1H), 8.38 (d, 1H), 8.83 (d, 1H).
b-21	2.59 (s, 3H), 2.80 (t, 2H), 4.07 (t, 2H), 4.73 (s, 2H), 6.65 (d, 1H), 6.91 (t, 1H), 6.97 (d, 1H), 7.28–7.35 (m, 1H), 8.24 (d, 1H).
b-22	1.73 (d, 6H), 2.02 (s, 1H), 3.02 (t, 2H), 4.07 (t, 2H), 4.73 (s, 2H), 6.57 (d, 1H), 6.82–6.89 (m, 1H), 6.98 (d, 1H), 7.10–7.15 (m, 1H), 8.25 (d, 1H).
b-23	2.63 (s, 3H), 6.60 (d, 1H), 6.77 (d, 2H), 6.89 (t, 1H), 7.25–7.32 (m, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 8.16 (d, 1H).

[0281] (製剤)

次に、本発明に係る殺菌剤の実施例を若干示すが、添加物および添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。また、製剤実施例中の部は重量部を示す。

[0282] 製剤実施例 1 水和剤

本発明化合物	40部
クレー	48部
ジオクチルスルホサキシネートナトリウム塩	4部
リグニンスルホン酸ナトリウム塩	8部

以上を均一に混合して微細に粉碎し、有効成分40%の水和剤を得る。

[0283] 製剤実施例 2 乳剤

本発明化合物	10部
ソルベッソ200	53部
シクロヘキサノン	26部
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム塩	1部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	10部

以上を混合溶解し、有効成分10%の乳剤を得る。

[0284] 製剤実施例 3 粉剤

本発明化合物	10部
クレー	90部

以上を均一に混合して微細に粉砕し、有効成分10%の粉剤を得る。

[0285] 製剤実施例 4 粒剤

本発明化合物	5部
クレー	73部
ベントナイト	20部
ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩	1部
リン酸カリウム	1部

以上をよく粉砕混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分5%の粒剤を得る。

[0286] 製剤実施例 5 懸濁剤

本発明化合物	10部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	4部
ポリカルボン酸ナトリウム塩	2部
グリセリン	10部
キサントガム	0.2部
水	73.8部

以上を混合し、粒度が3ミクロン以下になるまで湿式粉砕し、有効成分10%の懸濁剤を得る。

[0287] 製剤実施例 6 顆粒水和剤

本発明化合物	40部
クレー	36部
塩化カリウム	10部
アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩	1部
リグニンスルホン酸ナトリウム塩	8部

アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩のホルムアルデヒド縮合物

5 部

以上を均一に混合して微細に粉碎後、適量の水を加えてから練り込んで粘土状にする。粘土状物を造粒した後乾燥し、有効成分40%の顆粒水和剤を得る。

[0288] (生物試験例1) リンゴ黒星病防除試験

素焼きポットで栽培したリンゴ幼苗（品種「国光」、3～4葉期）に、本発明化合物の乳剤を有効成分100ppmの濃度で散布した。室温で自然乾燥した後、リンゴ黒星病菌（*Venturia inaequalis*）の分生胞子を接種し、明暗を12時間毎に繰り返す20℃、高湿度の室内に2週間保持した。葉上の病斑出現状態を無処理と比較調査し、防除効果を求めた。

化合物番号3、6、7、8、10、11、12、14、15、16、17、18、19、20、21、22、24、25、26、28、29、30、31、33、34、35、36、37、38、40、41、43、44、45、46、48、49、52、53、54、57、59、60、61、62、63、64、65、および66の化合物についてリンゴ黒星病防除試験を行った。その結果、いずれの化合物も75%以上の防除価を示した。

さらに、化合物番号67、68、70、73、74、75、76、77、78、79、80、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、190、192、193、194、195、196、197、198、199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、209、210、211、215、217、218、219、220、221、222、223、224、225、227、228、229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、239、240、242、243、244、245、246、247、248、249、250、251、252

、253、254、255、256、257、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、269、270、271、272、273、274、276、277、278、279、280、281、283、284、285、288、289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、299、300、306、308、309、310、311、314、315、316、317、318、319、320、321、322、323、324、325、327、328、329、330、331、332、333、334、335、344、347、348、349、350、353、354、355、356、357、358、359、360、361、362、363、364、365、366、367、368、369、370、371、372、373、374、375、376、377、378、379、380、381、382、383、384、385、386、387、388、389、390、391、392、393、394、395、396、397、398、399、400、402、403、404、406、407、408、409、410、411、412、413、414、416、417、418、419、423、424、425、426、427、428、429、430、431、432、433、434、435、437、439、440、441、442、443、445、a-2、a-3、a-4、a-5、a-6、a-7、a-8、a-9、a-10、b-1、b-2、b-3、b-4、b-5、b-6、b-7、b-8、b-9、b-10、b-11、b-12、b-13、b-14、b-15、b-16、b-17、b-20、b-22、b-23、b-24、c-2、c-3、c-4、c-5、d-5、およびd-6の化合物についても同様の試験を行った。その結果、いずれの化合物も75%以上の防除価を示した。

[0289] (生物試験例2) キュウリ灰色かび病防除試験

素焼きポットで栽培したキュウリ幼苗（品種「相模半白」、子葉期）に、本発明化合物の乳剤を有効成分100ppmの濃度で散布した。室温で自然乾燥した後、キュウリ灰色かび病菌（*Botrytis cinerea*）の分生孢子懸濁液を滴下接種し、暗所、20℃、高湿度の室内に4日間保持した。葉上の病斑出現状態を無処理と比較調査し、防除効果を求めた。

化合物番号10、11、12、15、18、19、22、26、29、30、31、33、34、35、36、37、38、42、43、44、48、49、54、57、および59の化合物についてキュウリ灰色かび病防除試験を行った。その結果、いずれの化合物も75%以上の防除価を示した。

さらに、化合物番号67、73、75、76、77、80、81、82、83、86、88、89、90、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、104、106、107、108

、109、110、111、113、114、115、116、117、118、119、122、123、124、125、126、127、128、133、134、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、156、157、158、159、160、162、163、164、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、183、184、185、186、187、188、192、197、198、199、200、201、202、203、205、208、209、210、219、220、221、222、223、225、227、228、229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、239、240、241、242、243、244、245、246、247、248、249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、269、270、271、272、274、275、278、281、284、285、291、292、293、295、296、297、298、299、308、309、310、311、314、315、316、317、318、319、323、324、325、326、327、328、332、333、338、340、344、348、353、355、359、360、361、363、364、365、371、375、376、377、378、379、380、381、382、386、391、392、393、395、397、398、399、402、403、405、406、412、414、416、417、418、423、424、425、426、427、428、429、431、432、433、434、435、436、437、439、440、441、442、444、a-2、a-5、a-6、a-7、a-8、a-10、b-1、b-2、b-3、b-7、b-8、b-12、b-16、c-3、およびc-4の化合物についても同様の試験を行った。その結果、いずれの化合物も75%以上の防除価を示した。

[0290] (生物試験3) 水稻いもち病水面施用試験

市販培土を詰め湛水状態にしたポットでイネ幼苗を栽培し（品種「コシヒカリ」、1葉期）、本発明化合物の乳剤を有効成分400ppmの濃度で水面へ点滴処理した。2日後、イネいもち病菌（*Magnaporthe grisea*）の分生孢子懸濁液を噴霧接種し、暗所、25℃、高湿度の室内に2日間保持した後、明暗を12時間毎に繰り返す25℃の室内に8日間保持した。葉上の病斑出現状態を無処理と比較調査し、下記の基準で防除効果を判定した。

A（防除価60%以上）

B（防除価40以上60%未満）

本試験の結果、下記の化合物の防除効果はAであった。

化合物番号：5、20、21、23、25、28、32、33、34、36、37、38、43、44、48、58、66、70、71、73、78、84、85、88、89、90、106、107、227、228、234、236、260、262、348、353、356、358、375、376、401、402、a-6

また、下記の化合物の防除効果はBであった。

化合物番号：1、3、7、12、13、22、46、54、55、75、95、98、139、151、261、359、360、b-1

[0291] (生物試験4) 水稻いもち病水面施用試験

市販培土を詰め湛水状態にしたポットでイネ幼苗を栽培し（品種「コシヒカリ」、1葉期）、本発明化合物の乳剤を有効成分400ppmの濃度で水面へ点滴処理した。14日後、イネいもち病菌（*Magnaporthe grisea*）の分生孢子懸濁液を噴霧接種し、暗所、25℃、高湿度の室内に2日間保持した後、明暗を12時間毎に繰り返す25℃の室内に8日間保持した。葉上の病斑出現状態を無処理と比較調査し、下記の基準で防除効果を判定した。

A（防除価60%以上）

B（防除価40以上60%未満）

本試験の結果、下記の化合物の防除効果はAであった。

化合物番号：21、36、37、38、43、44、48、84、88、89、95、106、109、125、262、266、267、292、350、375、a-6

また、下記の化合物の防除効果はBであった。

化合物番号：236

[0292] (生物試験5) キュウリつる割病種子処理試験

キュウリつる割病菌（*Fusarium oxysporum*）によって汚染されたキュウリ種子（品種「相模半白」）に対して本発明化合物の乳剤を有効成分1g/kg種子となるように種子処理した。これら種子を播種し、3週間後に発病程度を無処理と比較調査し、防除効果を求めた。

その結果、下記の化合物が75%以上の優れた防除価を示した。

化合物番号：18、36、37、43、44、48、77、81、83、88、92、94、100、103

、109、126、225、227、228、234、235、241、242、243、244、252、258、266、268、298、395、397、425、435、a-6、a-7、a-8、b-8、b-12、c-4

[0293] (生物試験6) キュウリつる割病種子処理試験

キュウリ種子(品種「相模半白」)に対して本発明化合物の乳剤を有効成分1g/kg種子となるように種子処理した。これら種子をキュウリつる割病菌(*Fusarium oxysporum*)によって汚染された土壌に播種し、3週間後に発病程度を無処理と比較調査し、防除効果を求めた。

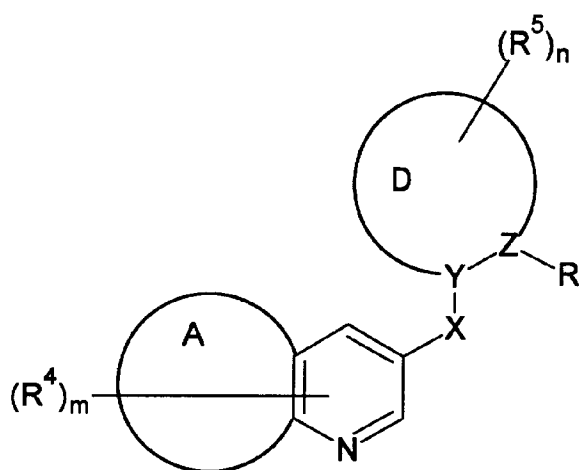
その結果、下記の化合物が75%以上の優れた防除価を示した。

化合物番号: 17、18、31、33、34、35、36、37、43、86、88、96、97、100、109、227、232、239、242、243、244、262、265、268、295、296、375、428、a-7、b-1

請求の範囲

[請求項1] 式（I）で表される含窒素ヘテロ環化合物、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物。

[化1]



式（I）

〔式（I）中、Rは、 $CR^1R^2R^3$ で表される基、無置換の若しくは置換基を有するC6～10アリール基、またはシアノ基を表す。

$R^1 \sim R^3$ は、夫々独立して、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するC1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC2～8アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC2～8アルキニル基、無置換の若しくは置換基を有するC3～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC4～8シクロアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有するC1～8アシル基、無置換の若しくは置換基を有する（1-イミノ）C1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するカルボキシ基、無置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するメルカプト基、置換基を有するスルホニル基、ハロゲノ基、シアノ基、またはニトロ基を示す。

但し、 $R^1 \sim R^3$ は、全てが水素原子であることはない。また、 $R^1 \sim$

R^3 は、全てが無置換のC 1～8アルキル基であることはない。また、 $R^1 \sim R^3$ は、いずれかひとつが水素原子である場合、残る二つ全てが、無置換のC 1～8アルキル基であることはない。また、 $R^1 \sim R^3$ は、いずれかひとつが無置換のC 1～8アルキル基である場合、残る二つ全てが、水素原子であることはない。

R^1 と R^2 は一緒になって、無置換の若しくは置換基を有する5～8員環を形成してもよいし、または $O=$ 、 $R^a R^b C=$ 若しくは $R' - N=$ を形成してもよい。

R^a は、水素原子または無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基を示す。

R^b は、水素原子または無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基を示す。

R' は、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、または無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基を示す。

R^4 は、夫々独立して、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～8アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～8アルキニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 4～8シクロアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アシル基、無置換の若しくは置換基を有する(1-イミノ)C 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するカルボキシ基、無置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するメルカプト基、置換基を有するスルホニル基、ハロゲノ基、シアノ基、またはニトロ基を示す。

m は、 R^4 の個数を示し、0～6のいずれかの整数である。

R^5 は、夫々独立して、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～8アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～8アルキニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 4～8シクロアルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロ環基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～8アシル基、無置換の若しくは置換基を有する(1-イミノ)C 1～8アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するカルボキシル基、無置換の若しくは置換基を有するカルバモイル基、無置換の若しくは置換基を有する水酸基、無置換の若しくは置換基を有するアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するメルカプト基、置換基を有するスルホニル基、ハロゲノ基、シアノ基、またはニトロ基を示す。

n は、 R^5 の個数を示し、0～5のいずれかの整数である。

$R^1 \sim R^3$ のいずれかひとつと、 R^5 のいずれかひとつとは、一緒になって、無置換の若しくは置換基を有する5～8員環を形成してもよい。

Aは、RがC $R^1R^2R^3$ で表される基のとき、5～7員炭化水素環または5～7員ヘテロ環を示し、Rが無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基またはシアノ基のとき、ベンゼン環を表す。

Dは、5～7員炭化水素環または5～7員ヘテロ環を示す。

Xは、酸素原子、硫黄原子、スルフェニル基、スルホニル基、無置換の若しくは置換基を有する炭素原子、または無置換の若しくは置換基を有する窒素原子を示す。

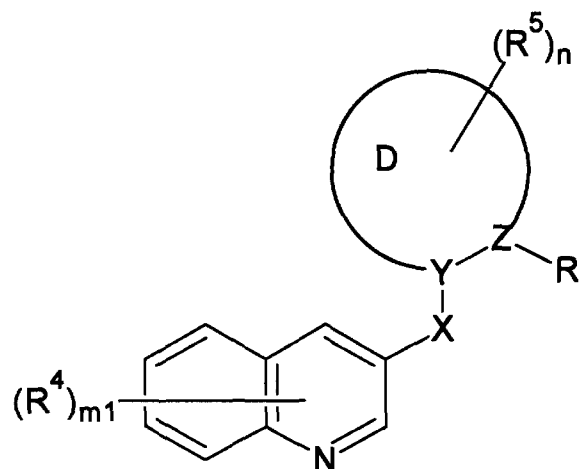
Yは、炭素原子、または窒素原子を示す。

Zは、炭素原子、または窒素原子を示す。]

[請求項2]

式(II)で表される含窒素ヘテロ環化合物、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物。

[化2]



式 (II)

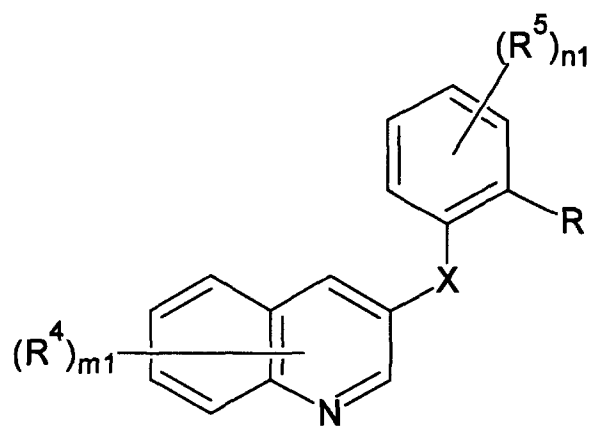
(式 (II) 中、R、R⁴、R⁵、n、D、X、YおよびZは、請求項1に記載の式 (I) 中のそれぞれと同じ意味を示す。

m₁は、R⁴の個数を示し、0～6のいずれかの整数である。)

[請求項3]

式 (III) で表される含窒素ヘテロ環化合物、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物。

[化3]



式 (III)

(式 (III) 中、R、R⁴、R⁵、m₁およびXは、請求項2に記載の式 (II) 中のそれぞれと同じ意味を示す。

n₁は、R⁵の個数を示し、0～4のいずれかの整数である。)

[請求項4]

請求項1～3のいずれか1項に記載の含窒素ヘテロ環化合物、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物から選ばれる少なくとも1種

を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

[請求項5]

8-フルオロ-3-ヒドロキシキノリン、7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシキノリン、7, 8-ジフルオロ-3-ヨードキノリン、8-フルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリン、または7, 8-ジフルオロ-3-ヒドロキシ-2-メチルキノリンから選ばれる請求項1に記載の式(I)で表される含窒素ヘテロ環化合物、またはその塩若しくはN-オキサイド化合物の製造中間体。